

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2019-537553

(P2019-537553A)

(43) 公表日 令和1年12月26日(2019.12.26)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>AO1N 43/836 (2006.01)</b>	AO1N 43/836	4C056
<b>AO1P 1/00 (2006.01)</b>	AO1P 1/00	4C063
<b>AO1P 3/00 (2006.01)</b>	AO1P 3/00	4C065
<b>CO7D 271/06 (2006.01)</b>	CO7D 271/06 CSP	4C072
<b>CO7D 413/12 (2006.01)</b>	CO7D 413/12	4H011
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 126 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2019-515891 (P2019-515891)  
 (86) (22) 出願日 平成29年9月22日 (2017. 9. 22)  
 (85) 翻訳文提出日 平成31年3月22日 (2019. 3. 22)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2017/074134  
 (87) 国際公開番号 W02018/055135  
 (87) 国際公開日 平成30年3月29日 (2018. 3. 29)  
 (31) 優先権主張番号 16190349.7  
 (32) 優先日 平成28年9月23日 (2016. 9. 23)  
 (33) 優先権主張国・地域又は機関 欧州特許庁 (EP)

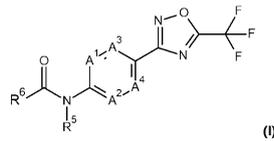
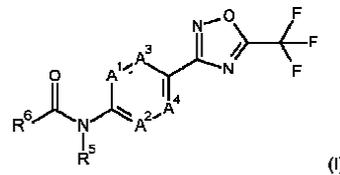
(71) 出願人 300091441  
 シンジェンタ パーティシペーションズ  
 アーゲー  
 スイス国4058 バーゼル、シュバルツ  
 バルトアレー 215  
 (74) 代理人 100094569  
 弁理士 田中 伸一郎  
 (74) 代理人 100103610  
 弁理士 ▲吉▼田 和彦  
 (74) 代理人 100109070  
 弁理士 須田 洋之  
 (74) 代理人 100119013  
 弁理士 山崎 一夫  
 (74) 代理人 100123777  
 弁理士 市川 さつき

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺微生物オキサジアゾール誘導体

(57) 【要約】

植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除もしくは予防する方法であって、ここで、殺菌・殺カビ的に有効な量の式(I)の化合物(式中、置換基は、請求項1に記載の通りである)を、植物、植物の一部またはその生息地に適用する。

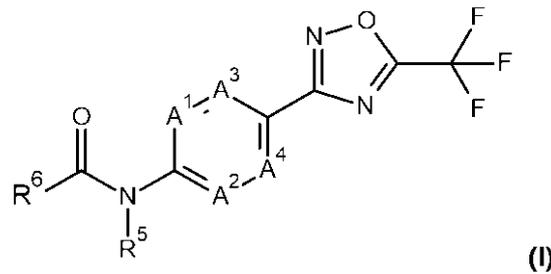


## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除もしくは予防する方法であって、殺菌・殺カビ的に有効な量の式 (I) :

## 【化 1】



(I)

10

[ 式中、

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>は、互いに独立して、NまたはC - Hを表し、ここで、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>の少なくとも2つは、C - Hであり；

R<sup>5</sup>は、水素、C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、C<sub>1-4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>3-4</sub>アルケニル、C<sub>3-4</sub>アルキニル、C<sub>1-4</sub>アルキルアミノカルボニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルまたはC<sub>3-6</sub>シクロアルキルC<sub>1-2</sub>アルキルであり；

20

R<sup>6</sup>は、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニル、C<sub>3-6</sub>アルキニル、C<sub>1-4</sub>フルオロアルキル、C<sub>3-6</sub>ハロアルケニル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、C<sub>1-4</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキル、ヒドロキシC<sub>1-4</sub>アルキル、ヒドロキシC<sub>1-4</sub>ハロアルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルキルカルボニルオキシC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>フルオロアルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノ、N - C<sub>1-2</sub>アルコキシ - N - C<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、N - C<sub>1-2</sub>アルコキシ - N - C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルファニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルホニルC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケノキシアミノ、N - C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシ - N - C<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、シアノC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-3</sub>アルキル、N - C<sub>1-2</sub>アルコキシ - N - C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-3</sub>アルキルアミノ、フェニル、フェニルC<sub>1-3</sub>アルキル、フェノキシC<sub>1-2</sub>アルキル、フェニルC<sub>1-3</sub>ハロアルキル、フェニルC<sub>1-2</sub>アルコキシ、フェニルC<sub>1-3</sub>アルコキシアミノ、フェニルスルファニルC<sub>1-3</sub>アルキル、ナフチルC<sub>2-3</sub>アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル（ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルC<sub>1-3</sub>アルキルまたはヘテロシクリルオキシC<sub>1-3</sub>アルキル（ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4～6員非芳香族環である）、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリルC<sub>1-2</sub>アルキル（ここで、前記ヘテロビシクリル部分は、N、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員～11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋二環式環系である）であり、ここで、

30

40

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>7</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意に置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>8</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で任意に置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>7</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個も

50

しくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基でさらに置換されており；

$R^7$ は、シアノ、ハロゲン、メチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、シクロプロピル、 $C_{1-4}$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、ジ- $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニルアミノを表し；

あるいは、 $R^6$ が、シクロアルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロピシクリルであるとき、 $R^7$ は、オキソ(=O)を表してもよく；

$R^8$ は、フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニルアミノ、モルホリニル、ヘテロアリール、ヘテロアリーロキシまたはヘテロアリールカルボニルアミノ(ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ、ベンジルオキシカルボニルアミノを表し、ここで、前記フェニル、モルホリニル、またはヘテロアリール部分のいずれかは、 $R^9$ から選択される、同じでも異なってもよい1個、2個もしくは3個の置換基で任意に置換されており；

$R^9$ は、メチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シアノ、およびアミノを表す]

の化合物またはその塩もしくはN-オキシド；

あるいは式(I)の化合物を活性成分として含む組成物を、前記植物、その一部またはその生息地に適用するが；

前記式(I)の化合物は、

1-メトキシ-1-メチル-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素；

エチルN-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート；

N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド；

N-[4-[5-(トリフルオロメトキシ)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド；

メチルN-[4-[5-(トリフルオロメトキシ)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート；または

イソプロピルN-[4-[5-(トリフルオロメトキシ)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバメートではないことを特徴とする、方法。

#### 【請求項2】

前記式(I)の化合物において、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の少なくとも3つが、C-Hであり、ここで、 $A^1$ が、Nであるとき、 $A^2$ ~ $A^4$ の全てが、C-Hを表し、 $A^4$ が、Nであるとき、 $A^1$ 、 $A^2$ 、および $A^3$ の全てが、C-Hを表すか、または $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の全てが、C-Hを表す、請求項1に記載の方法。

#### 【請求項3】

前記式(I)の化合物において、 $R^5$ が、水素、メチル、エチル、メトキシ、アセチル、N-tert-ブチルアミノカルボニルメチル、(N-tert-ブチルアミノカルボニル)-1-エチル、および(N-tert-ブチルアミノカルボニル)-1-メチル-1-エチルを表す、請求項1または請求項2に記載の方法。

#### 【請求項4】

前記式(I)の化合物において、 $R^6$ が、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{3-5}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ フルオロアルキル、 $C_{3-6}$ ハロアルケニル、 $C_{1-2}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-2}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{2-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニルオキシ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{1-3}$ フルオロアルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{1-3}$ アルキルアミノ

10

20

30

40

50

、N - C<sub>1-2</sub>アルコキシ - N - C<sub>1-2</sub>アルコキシ C<sub>1-3</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシ C<sub>1-2</sub>アルコキシ C<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシカルボニル C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルファニル C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルホニル C<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシアミノ、N - C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシ - N - C<sub>1-2</sub>アルキルアミノ、シアノ C<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル C<sub>1-3</sub>アルキル、N - C<sub>1-2</sub>アルコキシ - N - C<sub>3-6</sub>シクロアルキル C<sub>1-2</sub>アルキルアミノ、フェニル、フェニル C<sub>1-3</sub>アルキル、フェノキシ C<sub>1-2</sub>アルキル、フェニル C<sub>1-2</sub>ハロアルキル、フェニル C<sub>1-2</sub>アルコキシ、フェニル C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノ、フェニルスルファニル C<sub>1-2</sub>アルキル、ナフチル C<sub>2-3</sub>アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール C<sub>1-3</sub>アルキル（ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル C<sub>1-3</sub>アルキルまたはヘテロシクリルオキシ C<sub>1-3</sub>アルキル（ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4～6員非芳香族環である）、ヘテロビスクリル、ヘテロビスクリル C<sub>1-2</sub>アルキル（ここで、前記ヘテロビスクリル部分は、N、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員～11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋二環式環系である）を表し、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビスクリル部分のいずれかが、R<sup>7</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意に置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビスクリル部分のいずれかが、R<sup>8</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で任意に置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビスクリル部分のいずれかが、R<sup>7</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつR<sup>8</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている、請求項1～3のいずれか一項に記載の方法。

#### 【請求項5】

前記式(I)の化合物において、R<sup>6</sup>が、C<sub>1-5</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニル、C<sub>4-5</sub>アルキニル、C<sub>1-3</sub>フルオロアルキル、C<sub>3-5</sub>ハロアルケニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシ、C<sub>1-3</sub>アルコキシ C<sub>1-3</sub>アルキル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシ C<sub>2-4</sub>クロロアルキル、メチルカルボニル、メチルカルボニルオキシメチル、メトキシアミノ、N - メトキシ - N - C<sub>1-2</sub>アルキルアミノ、N - メトキシ - N - メトキシエチルアミノ、メトキシエトキシメチル、メトキシカルボニル C<sub>2-4</sub>アルキル、メチルスルファニル C<sub>3</sub>アルキル、メチルスルホニルメチル、C<sub>3-4</sub>アルケニルオキシアミノ、N - C<sub>3-4</sub>アルケニルオキシ - N - メチルアミノ、シアノメチル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル C<sub>1-2</sub>アルキル、N - メトキシ - N - シクロプロピルメチルアミノ、フェニル、フェニル C<sub>1-2</sub>アルキル、フェノキシ C<sub>1-2</sub>アルキル、フェニルハロメチル、ベンジルオキシアミノ、フェニルスルファニルメチル、ナフチル C<sub>2</sub>アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール C<sub>1-3</sub>アルキル（ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である）、ヘテロシクリル（ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4～6員非芳香族環である）、ヘテロビスクリル、およびヘテロビスクリルメチル（ここで、前記ヘテロビスクリル部分は、N、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員～10員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋二環式環系である）を表し、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビスクリル部分のいずれかが、R<sup>7</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意に置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビスクリル部分のいずれかが、R<sup>8</sup>から選択される、同じでも異なってもよい1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意に置換されているか；あるいは

10

20

30

40

50

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロピシクリル部分のいずれかが、 $R^8$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で任意に置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロピシクリル部分のいずれかが、 $R^7$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている、請求項1～4のいずれか一項に記載の方法。

【請求項6】

前記式(I)の化合物において、 $R^6$ が、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*n*-ペンタ-2-イル、*n*-ペンタ-3-イル、3-メチルブチン-3-イル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、エトキシ、メトキシメチル、2-メトキシエチル、メトキシプロピル、*N*-メトキシアミノ、*N*-メチル-*N*-メトキシアミノ、*N*-アリルオキシアミノ、*N*-アリルオキシ-*N*-メチルアミノ、*N*-2-メチルアリルオキシアミノ、*N*-メチル-*N*-(2-メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル、1-メトキシ-1-(2-メトキシエチル)アミノ、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、1-メチルシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、2-メチルシクロブチル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンテン-1-イル、3-メチルオキサタン-3-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロピラン-2-イル、2-クロロフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、2-(*N*-イソプロピルアミノカルボニル)-3-(フルオロ)フェニル、4-メトキシ-*N*-ピペラジン-1-イル、*N*-オキサジナン-2-イル、6-モルホリノピラジン-2-イル、4-プロパンアミドフェニルメチル、3-メトキシ-5-オキソ-シクロヘキセン-3-イル、(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)メチル、および2-(1,3-ベンゾジオゾール-5-イル)プロピルを表す、請求項1～5のいずれか一項に記載の方法。

【請求項7】

前記式(I)の化合物において、 $R^6$ が、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*n*-ペンタ-2-イル、*n*-ペンタ-3-イル、3-メチル-ブチン-3-イル、*N*-アリルオキシアミノ、メトキシメチル、*N*-メトキシアミノ、*N*-エチル-*N*-メトキシアミノ、*N*-2-メチルアリルオキシアミノ、*N*-アリルオキシ-*N*-メチルアミノ、*N*-メトキシ-*N*-(2-メトキシエチル)アミノ、*N*-メチル-*N*-(2-メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、2-メトキシエチル、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、3-メチルオキサタン-3-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロピラン-2-イル、シクロペンテン-1-イル、2-(*N*-イソプロピルアミノカルボニル)-3-(フルオロ)フェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、4-メトキシ-*N*-ピペラジン-1-イル、*N*-オキサジナン-2-イル、6-モルホリノピラジン-2-イル、3-メトキシ-5-オキソ-シクロヘキセン-3-イル、(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)メチル、および2-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)フェニルを表す、請求項1～6のいずれか一項に記載の方法。

【請求項8】

前記式(I)の化合物において、 $R^6$ が、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、

イソブチル、s-ブチル、n-ペンタ-2-イル、n-ペンタ-3-イル、3-メチル-ブチン-3-イル、N-アリルオキシアミノ、N-エチル-N-メトキシアミノ、N-2-メチルアリルオキシアミノ、N-アリルオキシ-N-メチルアミノ、N-メトキシ-N-(2-メトキシエチル)アミノ、N-メチル-N-(2-メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、2-メトキシエチル、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、3-メチルオキサタン-3-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロピラン-2-イル、シクロペンテン-1-イル、2-(N-イソプロピルアミノカルボニル)-3-(フルオロ)フェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニルメチル、4-メトキシ-N-ピペラジン-1-イル、N-オキサジナン-2-イル、および2-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)フェニルを表す、請求項1~7のいずれか一項に記載の方法。

10

## 【請求項9】

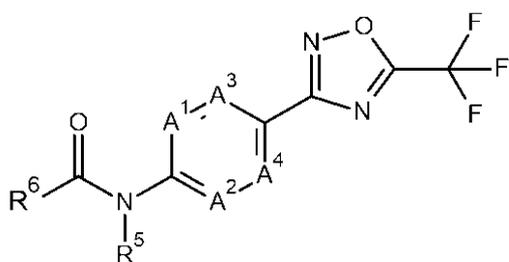
式(I)の化合物を含む前記組成物が、少なくとも1種のさらなる活性成分および/または農芸化学的に許容可能な希釈剤もしくはキャリアをさらに含む、請求項1~8のいずれか一項に記載の方法。

## 【請求項10】

式(IA)

20

## 【化2】



(IA)

【式中、

30

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>は、独立して、NまたはC-Hを表し、ここで、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>の少なくとも3つは、C-Hであり；

R<sup>5</sup>は、水素、C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、C<sub>1-4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>3-4</sub>アルケニル、C<sub>3-4</sub>アルキニル、C<sub>1-4</sub>アルキルアミノカルボニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3-6</sub>シクロアルキルC<sub>1-2</sub>アルキルであり；

R<sup>6</sup>は、C<sub>3-6</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニル、C<sub>3-6</sub>アルキニル、C<sub>2-4</sub>フルオロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキル、ヒドロキシC<sub>1-4</sub>アルキル、ヒドロキシC<sub>1-4</sub>ハロアルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルキルカルボニルオキシC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>フルオロアルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノ、N-C<sub>2-4</sub>アルキル-N-C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノ、N-C<sub>1-2</sub>アルコキシ-N-C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルファニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルホニルC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシアミノ、N-C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシ-N-C<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、シアノC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-3</sub>アルキル、N-C<sub>1-2</sub>アルコキシ-N-C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-3</sub>アルキルアミノ、フェニル、フェニルC<sub>1-3</sub>アルキル、フェノキシC<sub>1-2</sub>アルキル、フェニルC<sub>1-3</sub>ハロアルキル、フェニルC<sub>1-2</sub>アルコキシ、フェニルC<sub>1-3</sub>アルコキシアミノ、フェニルスルファニルC<sub>1-3</sub>アルキル、ナフチルC<sub>2-3</sub>アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル(ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立し

40

50

て選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-3}$ アルキルまたはヘテロシクリルオキシ $C_{1-3}$ アルキル(ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4~6員非芳香族環であり、前記ヘテロシクリル部分が、窒素原子を含有するとき、前記ヘテロシクリルは、窒素原子によって分子の残部に接続している)、ヘテロピシクリル、ヘテロピシクリル $C_{1-2}$ アルキル(ここで、前記ヘテロピシクリル部分は、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員~11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋環系である)であり、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロピシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じでも異なってもよい1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意に置換されているか;あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロピシクリル部分のいずれかは、 $R^8$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で任意に置換されているか;あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロピシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基でさらに置換されており;

$R^7$ は、メチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニルアミノ、シアノ、シクロプロピル、 $C_{1-4}$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、ジ- $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニルアミノを表し、

$R^8$ は、モルホリニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロシクリルカルボニルアミノ(ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ、ベンジルオキシカルボニルアミノを表し、ここで、前記ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、 $R^9$ から選択される、同じでも異なってもよい1個、2個もしくは3個の置換基で任意に置換されており;

$R^9$ は、メチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノ、およびアミノを表す]の化合物またはその塩もしくはN-オキシド。

【請求項11】

$R^6$ が、 $C_{3-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{3-6}$ アルキニル、 $C_{2-4}$ フルオロアルキル、 $C_{1-3}$ アルコキシ $C_{1-3}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-3}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{2-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニルオキシ $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ フルオロアルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{2-3}$ アルキルアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノカルボニル、 $C_{1-2}$ アルコキシカルボニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルファニル $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルホニル $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-5}$ アルケニルオキシアミノ、N- $C_{3-5}$ アルケニルオキシ-N- $C_{1-3}$ アルキルアミノ、シアノ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキル、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキルアミノ、フェニル、フェニル $C_{1-3}$ アルキル、フェノキシ $C_{1-2}$ アルキル、フェニル $C_{1-2}$ ハロアルキル、フェニル $C_{1-2}$ アルコキシ、フェニル $C_{1-3}$ アルコキシアミノ、フェニルスルファニル $C_{1-2}$ アルキル、ナフチル $C_{2-3}$ アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール $C_{1-3}$ アルキル(ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族

10

20

30

40

50

環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-3}$ アルキルまたはヘテロシクリルオキシ $C_{1-3}$ アルキル(ここで、前記ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4~6員非芳香族環であり、前記ヘテロシクリル部分が、窒素原子を含有するとき、前記ヘテロシクリルは、窒素原子によって分子の残部に接続している)、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリル $C_{1-2}$ アルキル(ここで、前記ヘテロビシクリル部分は、OおよびSから選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む7員~11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋環系である)を表し、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかが、 $R^7$ から選択される、同じでも異なってもよい1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意に置換されているか;あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかが、 $R^8$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で任意に置換されているか;あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ナフチル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかが、 $R^7$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じでも異なってもよい1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている、請求項10に記載の化合物。

#### 【請求項12】

殺菌・殺力比的に有効な量の請求項1~11のいずれか一項に記載の式(I)の化合物を含む、農芸化学組成物。

#### 【請求項13】

植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除もしくは予防する方法であって、殺菌・殺力比的に有効な量の請求項10~12のいずれか一項に記載の式(IA)の化合物、またはこの化合物を活性成分として含む組成物を、前記植物、その一部またはその生息地に適用することを特徴とする、方法。

#### 【請求項14】

前記組成物が、少なくとも1種のさらなる活性成分および/または農芸化学的に許容可能な希釈剤もしくはキャリアをさらに含む、請求項13に記載の方法。

#### 【請求項15】

殺菌・殺力剤としての、請求項10~12のいずれか一項に記載の式(IA)の化合物の使用。

#### 【発明の詳細な説明】

#### 【技術分野】

#### 【0001】

本発明は、例えば、特に殺菌・殺力( fungicidal )活性といった殺微生物活性を有する活性処方成分としての殺微生物オキサジアゾール誘導体に関する。本発明はまた、少なくとも1種のオキサジアゾール誘導体を含む農芸化学組成物、これらの化合物の調製プロセス、および、農業または園芸における、植物、収穫された食品作物、種子または非生体材料に対する特に真菌といった植物病原性微生物による外寄生を防除もしくは予防するためのオキサジアゾール誘導体または組成物の使用に関する。

#### 【背景技術】

#### 【0002】

国際公開第2015/185485号には、植物病原性真菌を駆除するための置換オキサジアゾールの使用が記載されている。

#### 【発明の概要】

#### 【課題を解決するための手段】

#### 【0003】

本発明によれば、植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除もしくは予防する方法を提供し、ここで、殺菌・殺力的に( fungicidally )有効な量の式(

10

20

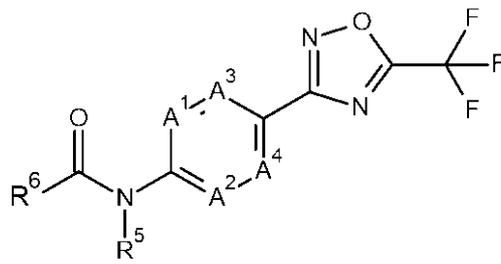
30

40

50

## I) の化合物

## 【化 1】



(I)

10

[ 式中、

$A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ は、互いに独立して、NまたはC - Hを表し、ここで、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の少なくとも2つは、C - Hであり；

$R^5$ は、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{3-4}$ アルケニル、 $C_{3-4}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキルまたは $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキルであり；

$R^6$ は、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{3-6}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ フルオロアルキル、 $C_{3-6}$ ハロアルケニル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-4}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニルオキシ $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ フルオロアルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコシアマミノ、N -  $C_{1-2}$ アルコキシ - N -  $C_{1-4}$ アルキルアミノ、N -  $C_{1-2}$ アルコキシ - N -  $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルコシアマミノカルボニル、 $C_{1-2}$ アルコシカルボニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルファニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルホニル $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケノキシアミノ (alkenoxamino)、N -  $C_{3-6}$ アルケニルオキシ - N -  $C_{1-4}$ アルキルアミノ、シアノ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-3}$ アルキル、N -  $C_{1-2}$ アルコキシ - N -  $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-3}$ アルキルアミノ、フェニル、フェニル $C_{1-3}$ アルキル、フェノキシ $C_{1-2}$ アルキル、フェニル $C_{1-3}$ ハロアルキル、フェニル $C_{1-2}$ アルコキシ、フェニル $C_{1-3}$ アルコシアマミノ、フェニルスルファニル $C_{1-3}$ アルキル、ナフチル $C_{2-3}$ アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール $C_{1-3}$ アルキル (ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-3}$ アルキルまたはヘテロシクリルオキシ $C_{1-3}$ アルキル (ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4 ~ 6員非芳香族環である)、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリル $C_{1-2}$ アルキル (ここで、ヘテロビシクリル部分は、N、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員 ~ 11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋二環式環系である) であり、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基でさらに置換されており；

$R^7$ は、シアノ、ハロゲン、メチル、エチル、イソプロピル、t - ブチル、ジフルオロメ

50

チル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、シクロプロピル、 $C_{1-4}$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、ジ- $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニルアミノを表し；

あるいは、 $R^6$ が、シクロアルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロピシクリルであるとき、 $R^7$ は、オキソ(=O)を表してもよく；

$R^8$ は、フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニルアミノ、モルホリニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールカルボニルアミノ(ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ、ベンジルオキシカルボニルアミノを表し、ここで、前記シクロプロピル、フェニル、モルホリニル、またはヘテロアリール部分のいずれかは、 $R^9$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており；

$R^9$ は、メチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シアノ、およびアミノを表す]；

またはその塩もしくはN-オキッド；

あるいは式(I)の化合物を活性成分として含む組成物を、植物、その一部またはその生息地に適用し；

ただし、式(I)の化合物は、

1-メトキシ-1-メチル-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素；

エチルN-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート；

N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド；

N-[4-[5-(トリフルオロメトキシ)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド；

メチルN-[4-[5-(トリフルオロメトキシ)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート；または

イソプロピルN-[4-[5-(トリフルオロメトキシ)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバメートではない。

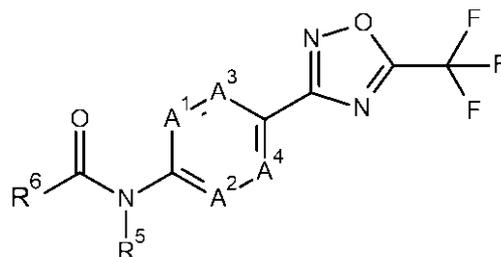
【0004】

本発明の第2の態様によると、植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除もしくは予防する方法を提供し、ここで、式(I)の化合物を含む組成物は、少なくとも1種のさらなる活性成分および/または農芸化学的に許容可能な希釈剤もしくはキャリアをさらに含む。

【0005】

本発明の第3の態様によると、式(IA)の化合物

【化2】



(IA)

[式中、

$A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ は、独立して、NまたはC-Hを表し、ここで、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の少なくとも3つは、C-Hであり；

10

20

30

40

50

R<sup>5</sup>は、水素、C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、C<sub>1-4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>3-4</sub>アルケニル、C<sub>3-4</sub>アルキニル、C<sub>1-4</sub>アルキルアミノカルボニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3-6</sub>シクロアルキルC<sub>1-2</sub>アルキルであり；

R<sup>6</sup>は、C<sub>3-6</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニル、C<sub>3-6</sub>アルキニル、C<sub>2-4</sub>フルオロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキル、ヒドロキシC<sub>1-4</sub>アルキル、ヒドロキシC<sub>1-4</sub>ハロアルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルキルカルボニルオキシC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>フルオロアルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノ、N - C<sub>2-4</sub>アルキル - N - C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノ、N - C<sub>1-2</sub>アルコキシ - N - C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルファニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルホニルC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシアミノ、N - C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシ - N - C<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、シアノC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-3</sub>アルキル、N - C<sub>1-2</sub>アルコキシ - N - C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-3</sub>アルキルアミノ、フェニル、フェニルC<sub>1-3</sub>アルキル、フェノキシC<sub>1-2</sub>アルキル、フェニルC<sub>1-3</sub>ハロアルキル、フェニルC<sub>1-2</sub>アルコキシ、フェニルC<sub>1-3</sub>アルコキシアミノ、フェニルスルファニルC<sub>1-3</sub>アルキル、ナフチルC<sub>2-3</sub>アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル（ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルC<sub>1-3</sub>アルキルまたはヘテロシクリルオキシC<sub>1-3</sub>アルキル（ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4～6員非芳香族環であり、ヘテロシクリル部分が、窒素原子を含有するとき、ヘテロシクリルは、窒素原子によって分子の残部に接続している）、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリルC<sub>1-2</sub>アルキル（ここで、ヘテロビシクリル部分は、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員～11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋環系である）であり、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>7</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>8</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>7</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつR<sup>8</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基でさらに置換されており；

R<sup>7</sup>は、メチル、エチル、イソプロピル、t - ブチル、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニルアミノ、シアノ、シクロプロピル、C<sub>1-4</sub>アルキルカルボニルアミノ、C<sub>1-4</sub>アルキルアミノカルボニル、ジ - C<sub>1-4</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1-4</sub>アルコキシカルボニルアミノC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニルカルボニルアミノを表し；

R<sup>8</sup>は、モルホリニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロシクリルカルボニルアミノ（ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である）、C<sub>1-4</sub>アルコキシカルボニルアミノ、ベンジルオキシカルボニルアミノを表し、ここで、前記ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、R<sup>9</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており；

；

10

20

30

40

50

R<sup>9</sup>は、メチル、エチル、イソプロピル、t-ブチル、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノ、およびアミノを表す]；

またはその塩もしくはN-オキシドを提供する。

【0006】

本発明の第4の態様によると、1-メトキシ-1-(2-メトキシエチル)-3-[4-  
 -[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]  
 ]尿素、N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-  
 -イル]フェニル]テトラヒドロフラン-2-カルボキサミド、1-アリルオキシ-3-  
 -[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェ  
 ニル]尿素、2-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキ  
 サジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド、1-メチル-N-  
 [4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェ  
 ニル]シクロプロパンカルボキサミド、1-フルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロ  
 メチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボ  
 キサミド、3-フルオロ-N<sup>2</sup>-イソプロピル-N<sup>1</sup>-[4-[5-(トリフルオロメチ  
 ル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]フタルアミド、2-(トリ  
 フルオロメチル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジア  
 ザール-3-イル]フェニル]ベンズアミド、2-(4-メトキシフェニル)-N-[4-  
 -[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]  
 ]アセトアミド、N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジア  
 ザール-3-イル]フェニル]テトラヒドロピラン-2-カルボキサミド、メチル<sub>2</sub>,<sub>2</sub>-  
 ジメチル-4-オキソ-4-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサ  
 ジアゾール-3-イル]アニリノ]ブタノエート、N-[4-[5-(トリフルオロメチ  
 ル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロペンテン-1-カル  
 ボキサミド、2-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキ  
 サジアゾール-3-イル]フェニル]ペentanアミド、2-エチル-N-[4-[5-(  
 トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンア  
 ミド、3-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジア  
 ザール-3-イル]フェニル]オキセタン-3-カルボキサミド、1-シアノ-N-[4-  
 -[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]  
 ]シクロプロパンカルボキサミド、2-フルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチ  
 ル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサ  
 ミド、2-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジ  
 アゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド、2,2-ジフルオロ-N-[4-[5-  
 -(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シク  
 ロプロパンカルボキサミド、2-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-N-[4-[5-  
 (トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ア  
 セトアミド、3,3,3-トリフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1  
 ,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド、2,2-ジメチル  
 -N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]  
 ]フェニル]ブタ-3-イナミド、1-エチル-1-メトキシ-3-[4-[5-(トリ  
 フルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素、1-(  
 2-メチルアリルオキシ)-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オ  
 キサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素、4-メトキシ-N-[4-[5-(トリフ  
 ルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ピペラジン-1  
 -カルボキサミド、1-メチル-1-(2-メチルアリルオキシ)-3-[4-[5-(  
 トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素、N  
 -[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フ  
 ェニル]ブタンアミド、3-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2  
 ,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンアミド、N-[4-[5-(トリ

10

20

30

40

50

フルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] シクロブタンカルボキサミド、N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ペンタンアミド、2 - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ブタンアミド、1 - アリルオキシ - 1 - メチル - 3 - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] 尿素、N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] オキサジナン - 2 - カルボキサミド、2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド、4, 4, 4 - トリフルオロ - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ブタンアミド、2 - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] プロパンアミド、および N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] シクロプロパンカルボキサミドから選択される式 (I) の化合物を提供する。

10

## 【0007】

本発明のさらなる態様によれば、1 - メトキシ - 1 - (2 - メトキシエチル) - 3 - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] 尿素、N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] テトラヒドロフラン - 2 - カルボキサミド、2 - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] シクロプロパンカルボキサミド、1 - フルオロ - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] シクロプロパンカルボキサミド、3 - フルオロ - N<sup>2</sup> - イソプロピル - N<sup>1</sup> - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] フタルアミド、2 - (トリフルオロメチル) - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ベンズアミド、2 - (4 - メトキシフェニル) - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド、N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] テトラヒドロピラン - 2 - カルボキサミド、メチル<sub>2</sub>, 2 - ジメチル - 4 - オキソ - 4 - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] アニリノ] ブタノエート、N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] シクロペンテン - 1 - カルボキサミド、2 - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ペンタンアミド、2 - エチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ブタンアミド、3 - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] オキサタン - 3 - カルボキサミド、2 - フルオロ - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] シクロプロパンカルボキサミド、2 - メトキシ - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] プロパンアミド、2, 2 - ジフルオロ - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] シクロプロパンカルボキサミド、2 - (2, 2 - ジフルオロシクロプロピル) - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド、3, 3, 3 - トリフルオロ - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] プロパンアミド、2, 2 - ジメチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ブタ - 3 - イナミド、1 - エチル - 1 - メトキシ - 3 - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] 尿素、1 - (2 - メチルアリルオキシ) - 3 - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロ

20

30

40

50

メチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] 尿素、4 - メトキシ - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ピペラジン - 1 - カルボキサミド、1 - メチル - 1 - (2 - メチルアリルオキシ) - 3 - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] 尿素、3 - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ブタンアミド、N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ペンタンアミド、2 - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ブタンアミド、2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド、4, 4, 4 - トリフルオロ - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] ブタンアミド、および 2 - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] プロパンアミドから選択される式 (I) の化合物を提供する。

10

## 【0008】

驚いたことに、式 (IA) の化合物は、実用的な目的のために、真菌によってもたらされる病害に対して植物を保護するための非常に有利なレベルの生物活性を有することが見出されてきた。

## 【0009】

本発明の第5の態様によると、殺菌・殺力比的に有効な量の請求項1~11のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物を含む農芸化学組成物を提供する。

20

## 【0010】

本発明の第6の態様によると、植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除もしくは予防する方法を提供し、殺菌・殺力比的に有効な量の式 (IA) の化合物、またはこの化合物を活性成分として含む組成物を、植物、その一部またはその生息地に適用する。

## 【0011】

本発明の第7の態様によると、植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除もしくは予防する方法を提供し、殺菌・殺力比的に有効な量の式 (IA) の化合物、またはこの化合物を活性成分として含む組成物は、少なくとも1種のさらなる活性成分および/または農芸化学的に許容可能な希釈剤もしくはキャリアをさらに含む。

30

## 【0012】

本発明の第8の態様によると、殺菌・殺力比剤 (fungicide) としての式 (IA) の化合物の使用を提供する。本発明のこの特定の態様によると、この使用は、手術または治療によるヒトまたは動物体の処置のための方法を除外し得る。

## 【発明を実施するための形態】

## 【0013】

本明細書において使用する場合、用語「ハロゲン」または「ハロ」は、フッ素 (フルオロ)、塩素 (クロロ)、臭素 (プロモ) またはヨウ素 (ヨード)、好ましくは、フッ素、塩素または臭素を指す。

40

## 【0014】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-6}$ アルキル」は、炭素および水素原子のみからなり、不飽和を含有せず、1~6個の炭素原子を有し、かつ単結合によって分子の残部に付着している、直鎖状または分岐状の炭化水素鎖ラジカルを指す。 $C_{1-5}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキル、および $C_1$ アルキルは、相応に解釈されるべきである。 $C_{1-6}$ アルキルの例には、これらに限定されないが、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、1-メチルエチル (イソプロピル)、 $n$ -ブチル、および1-ジメチルエチル (t-ブチル) が含まれる。「 $C_1 \sim C_6$ アルキレン」基は、このようなラジカルが2個の単結合によって分子の残部に付着していることを除いては、 $C_1 \sim C_6$ アルキル (および $C_{1-4}$ アルキル) の対応する定義を参照する。 $C_1 \sim C_6$ アルキレンの例には、これらに限

50

定されないが、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$  および  $-(CH_2)_3-$  が含まれる。

【0015】

本明細書において使用する場合、シアノは、 $-CN$ 基を意味する。

【0016】

本明細書において使用する場合、用語「ヒドロキシル」または「ヒドロキシ」は、 $-OH$ 基を意味する。

【0017】

本明細書において使用する場合、アミノは、 $-NH_2$ 基を意味する。

【0018】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ アルコキシ」は、式 $-OR_a$ のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルである。 $C_{1-3}$ アルコキシおよび $C_{1-2}$ アルコキシという用語は、相応に解釈されるべきである。 $C_{1-4}$ アルコキシの例には、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、および $t$ -ブトキシが含まれる。

10

【0019】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ ハロアルキル」は、同じまたは異なるハロゲン原子の1つもしくは複数で置換されている、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルを指す。 $C_{1-4}$ フルオロアルキルおよび $C_{1-3}$ フルオロアルキルという用語は、相応に解釈されるべきである。 $C_{1-4}$ ハロアルキルの例には、これらに限定されないが、フルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、 $2, 2, 2$ -トリフルオロエチル、および $3, 3, 3$ -トリフルオロプロピルが含まれる。

20

【0020】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{2-6}$ アルケニル」は、炭素および水素原子のみからなり、(E)配置または(Z)配置でよい少なくとも1個の二重結合を含有し、2~6個の炭素原子を有し、かつ単結合によって分子の残部に付着している、直鎖状または分岐状の炭化水素鎖ラジカル基を指す。 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{3-4}$ アルケニル、 $C_{2-3}$ アルケニル、および $C_2$ アルケニルは、相応に解釈されるべきである。 $C_{2-6}$ アルケニルの例には、これらに限定されないが、プロパ-1-エニル、アリル(プロパ-2-エニル)、およびブタ-1-エニルが含まれる。

30

【0021】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{3-6}$ ハロアルケニル」は、同じまたは異なるハロゲン原子の1つもしくは複数で置換されている、一般に上記に定義されているような $C_{3-6}$ アルケニルラジカルを指す。 $C_{3-5}$ ハロアルケニルは、相応に解釈されるべきである。

【0022】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{3-6}$ アルキニル」は、炭素および水素原子のみからなり、少なくとも1個の三重結合を含有し、3~6個の炭素原子を有し、かつ単結合によって分子の残部に付着している、直鎖状または分岐状の炭化水素鎖ラジカル基を指す。 $C_{3-5}$ アルキニル、 $C_{3-4}$ アルキニル、および $C_{4-5}$ アルキニルは、相応に解釈されるべきである。 $C_{3-6}$ アルキニルの例には、これらに限定されないが、プロパ-1-イニル、プロパルギル(プロパ-2-イニル)、およびブタ-1-イニルが含まれる。

40

【0023】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキル」は、式 $R_b-O-R_a-$ のラジカルを指し、ここで、 $R_b$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルであり、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキレンラジカルである。 $C_{1-4}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルコキシ $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキルおよび $C_1$ アルコキシ $C_{1-3}$ アルキルは、相応に解釈されるべきである。

【0024】

50

本明細書において使用する場合、用語「ヒドロキシ $C_{1-4}$ アルキル」は、1個もしくは複数のヒドロキシ基で置換されている、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルを指す。用語「ヒドロキシ $C_{1-2}$ アルキル」は、相応に解釈されるべきである。

【0025】

本明細書において使用する場合、用語「ヒドロキシ $C_{1-4}$ ハロアルキル」は、1個もしくは複数のヒドロキシ基で置換されている、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ ハロアルキルラジカルを指す。用語「ヒドロキシ $C_{1-4}$ クロロアルキル」は、相応に解釈されるべきである。

【0026】

本明細書において使用する場合、用語「シアノ $C_{1-2}$ アルキル」は、1個もしくは複数のシアノ基で置換されている、一般に上記に定義されているような $C_{1-2}$ アルキルラジカルを指す。シアノ $C_1$ アルキルは、相応に解釈されるべきである。

【0027】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ アルキルカルボニル」は、式 $-C(O)R_a$ のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルである。用語「 $C_{1-2}$ アルキルカルボニル」は、相応に解釈されるべきである。

【0028】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-2}$ アルコキシアミノ」は、式 $R_aONH-$ のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-2}$ アルキルラジカルである。用語「 $C_1$ アルコキシアミノ」は、相応に解釈されるべきである。

【0029】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-2}$ アルキルカルボニルオキシ $C_{1-4}$ アルキル」は、式 $R_bC(O)OR_a-$ のラジカルを指し、ここで、 $R_b$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-2}$ アルキルラジカルであり、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキレンラジカルである。用語「 $C_1$ アルキルカルボニルオキシ $C_1$ アルキル」は、相応に解釈されるべきである。

【0030】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ アルキルカルボニルアミノ」は、式 $R_aC(O)NH-$ のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルである。

【0031】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル」は、式 $R_aNHCO-$ のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルである。

【0032】

用語「 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ $C_{1-4}$ アルキル」は、式 $R_aOC(O)NHR_b-$ のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルであり、 $R_b$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキレンラジカルである。

【0033】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ フルオロアルキルアミノ」は、式 $R_aNH-$ のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、1個もしくは複数のフッ素原子で置換されている、一般に上記に定義されているような $C_{1-4}$ アルキルラジカルである。

【0034】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルキル」は、式 $R_aOR_bOR_c-$ のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ および $R_b$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-2}$ アルキルラジカルであり、 $R_c$ は、一般に上記に定義されているような $C_{1-2}$ アルキレンラジカルである。

10

20

30

40

50

## 【 0 0 3 5 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-2}$ アルコキシアミノカルボニル」は、式  $R_a$  ONHC(O) - のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-2}$ アルキルラジカルである。

## 【 0 0 3 6 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニルアミノ」は、式  $R_a$  C(O)NH - のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{2-6}$ アルケニルラジカルである。

## 【 0 0 3 7 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-2}$ アルコキシカルボニル  $C_{1-4}$ アルキル」は、式  $R_a$ OC(O) $R_b$  - のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-2}$ アルキルラジカルであり、 $R_b$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-4}$ アルキレンラジカルである。用語「 $C_1$ アルコキシカルボニル  $C_{2-4}$ アルキル」は、相応に解釈されるべきである。

10

## 【 0 0 3 8 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-2}$ アルキルスルファニル  $C_{1-4}$ アルキル」は、式  $R_a$ SR $b$  - のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-2}$ アルキルラジカルであり、 $R_b$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-4}$ アルキレンラジカルである。用語「 $C_1$ アルキルスルファニル  $C_3$ アルキル」は、相応に解釈されるべきである。

20

## 【 0 0 3 9 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-2}$ アルキルスルホニル  $C_{1-2}$ アルキル」は、式  $R_a$ S(O) $R_b$  - のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-2}$ アルキルラジカルであり、 $R_b$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-2}$ アルキレンラジカルである。用語「 $C_1$ アルキルスルホニル  $C_1$ アルキル」は、相応に解釈されるべきである。

## 【 0 0 4 0 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{3-6}$ アルケニルオキシアミノ」は、式  $R_a$ ONH - のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{3-6}$ アルケニルラジカルである。用語「 $C_{3-4}$ アルケニルオキシアミノ」は、相応に解釈されるべきである。

30

## 【 0 0 4 1 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ アルキルカルボニル  $C_{1-4}$ アルキル」は、式  $R_a$ C(O) $R_b$  - のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-4}$ アルキルであり、 $R_b$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-4}$ アルキレンラジカルである。

## 【 0 0 4 2 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル」は、式  $R_a$ NHC(O) - のラジカルを指し、ここで、 $R_a$ は、一般に上記に定義されているような  $C_{1-4}$ アルキルラジカルである。

40

## 【 0 0 4 3 】

本明細書において使用する場合、用語「ジ  $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル」は、式 ( $R_a$ ) $R_a$ NHC(O) - のラジカルを指し、ここで、各  $R_a$ は、独立して、一般に上記に定義されているような  $C_{1-4}$ アルキルラジカルである。

## 【 0 0 4 4 】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{3-8}$ シクロアルキル」は、飽和もしくは部分不飽和であり、かつ3～8個の炭素原子を含有する安定な単環式環ラジカルを指す。 $C_{3-6}$ シクロアルキルは、相応に解釈されるべきである。 $C_{3-8}$ シクロアルキルの例には、これらに限定されないが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロペンテン - 1 - イル、シクロペンテン - 3 - イル、およびシクロヘキセン - 3 -

50

イルが含まれる。

【0045】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-3}$ アルキル」は、上記に定義されているような $C_{1-3}$ アルキレンラジカルによって分子の残部に付着している、上記に定義されているような $C_{3-8}$ シクロアルキル環を指す。用語「 $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-3}$ アルキル」および「 $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキル」は、相応に解釈されるべきである。 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-3}$ アルキルの例には、これらに限定されないが、シクロプロピル-メチル、シクロブチル-エチル、およびシクロペンチル-プロピルが含まれる。

【0046】

本明細書において使用する場合、用語「フェニル $C_{1-3}$ アルキル」は、上記に定義されているような $C_{1-3}$ アルキレンラジカルによって分子の残部に付着している、フェニル環を指す。フェニル $C_{1-3}$ アルキルの例には、これらに限定されないが、ベンジルが含まれる。

10

【0047】

本明細書において使用する場合、用語「フェニル $C_{1-3}$ ハロアルキル」は、同じまたは異なるハロゲン原子の1つもしくは複数で置換されている、一般に上記に定義されているような $C_{1-3}$ アルキレンラジカルによって分子の残部に付着しているフェニル環を指す。

【0048】

本明細書において使用する場合、用語「フェノキシ $C_{1-2}$ アルキル」は、上記に定義されているような $C_{1-2}$ アルキレンラジカルによって分子の残部に付着している、フェノキシラジカル(PhO-)を指す。

20

【0049】

本明細書において使用する場合、用語「フェニルスルファニル $C_{1-3}$ アルキル」は、上記に定義されているような $C_{1-3}$ アルキレンラジカルによって分子の残部に付着している、フェニルスルファニルラジカル(PhS-)を指す。用語「フェニルスルファニル $C_1$ アルキル」は、相応に解釈されるべきである。

【0050】

本明細書において使用する場合、用語「フェニル $C_{1-2}$ アルコキシ」は、式PhR<sub>a</sub>O-のラジカルを指し、ここで、R<sub>a</sub>は、一般に上記に定義されているような $C_{1-2}$ アルキルラジカルである。

30

【0051】

本明細書において使用する場合、用語「フェニル $C_{1-3}$ アルコキシアミノ」は、式PhR<sub>a</sub>ONH-のラジカルを指し、ここで、R<sub>a</sub>は、一般に上記に定義されているような $C_{1-3}$ アルキルラジカルである。

【0052】

本明細書において使用する場合、用語「ナフチル $C_{2-3}$ アルケニル」は、上記に定義されているような $C_{2-3}$ アルケニルラジカルによって分子の残部に付着している、ナフチル縮合環系を指す。

【0053】

本明細書において使用する場合、用語「ヘテロアリアル」は、窒素、酸素および硫黄から個々に選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む、5員もしくは6員単環式芳香族環、または7員~11員芳香族縮合環ラジカルを指す。ヘテロアリアルラジカルは、炭素原子またはヘテロ原子を介して分子の残部に結合し得る。ヘテロアリアルラジカルの例には、これらに限定されないが、フラニル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジル、ピリジル、およびインドリルが含まれる。

40

【0054】

本明細書において使用する場合、用語「ヘテロアリアル $C_{1-3}$ アルキル」は、上記に定義されているような $C_{1-3}$ アルキレンラジカルによって分子の残部に付着している、上記

50

に定義されているようなヘテロアリール環を指す。

【0055】

本明細書において使用する場合、用語「ヘテロシクリル」または「複素環式」は、窒素、酸素および硫黄から個々に選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む、安定な飽和もしくは部分飽和の4員～6員、好ましくは、5員もしくは6員非芳香族単環式環、または7員～11員非芳香族縮合もしくは架橋環ラジカル（ヘテロシクリル）を指す。ヘテロシクリルラジカルは、炭素原子またはヘテロ原子を介して分子の残部に結合し得る。ヘテロシクリルの例には、これらに限定されないが、オキセタニル、ピロリジル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペリジル、ピペラジニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサソラニル、モルホリニル、ベンゾジオキサゾリル、ベンゾイミダゾール、およびオキサピシクロヘプタニルが含まれる。

10

【0056】

本明細書において使用する場合、用語「ヘテロシクリルC<sub>1-3</sub>アルキル」は、上記に定義されているようなC<sub>1-3</sub>アルキレンラジカルによって分子の残部に付着している、上記に定義されているような複素環式環を指す。

【0057】

本明細書において使用する場合、用語「ヘテロシクリルオキシC<sub>1-3</sub>アルキル」は、上記に定義されているようなC<sub>1-3</sub>アルキレンラジカルによって分子の残部に付着している、ヘテロシクリルオキシラジカル（HetO-）を指す。

【0058】

式（I）または（IA）の化合物中に1個以上の不斉炭素原子の存在が可能であるとは、その化合物がキラル異性形態、すなわち、鏡像異性形態またはジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、単結合に係る回転の制限によってアストロブ異性体が生じ得る。式（I）および（IA）は、すべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式（I）または（IA）の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含む。同様に、式（I）および（IA）は、存在する場合、すべての可能性のある互変異性体（ラクタム-ラクチム互変異性およびケト-エノール互変異性を含む）を含むことが意図されている。本発明は、式（I）または（IA）の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

20

【0059】

各事例において、本発明に係る式（I）および（IA）の化合物は、遊離形態、N-オキシドとしての酸化型、共有結合的に水和した形態、または、例えば農業経済学的に使用可能なまたは農芸化学的に許容可能な塩形態といった塩形態である。

30

【0060】

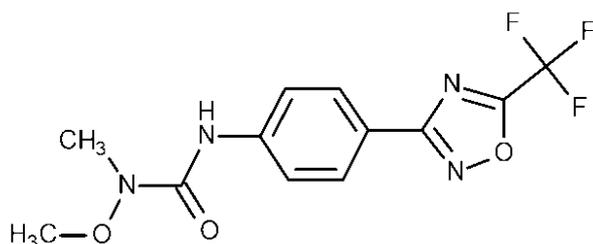
N-オキシドは、第三級アミンの酸化型、または、窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N-oxides”，A. Albin and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

【0061】

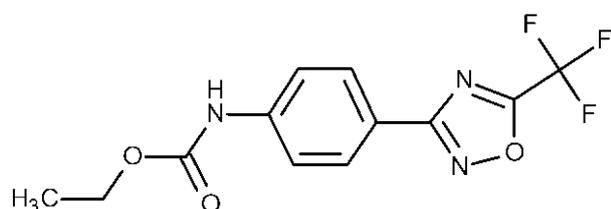
本発明によらない式（I）の化合物は、

40

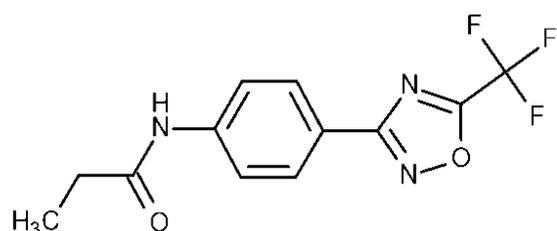
【化3】



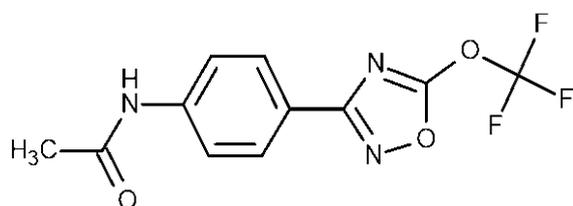
キサジアゾール - 3 - イル]フェニル]尿素;  
【化4】



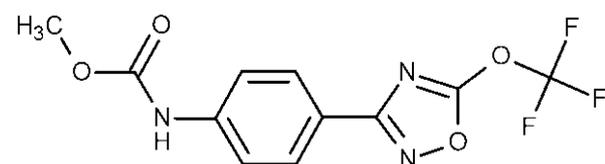
エチル N - [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] カルバメート ; 10  
【化5】



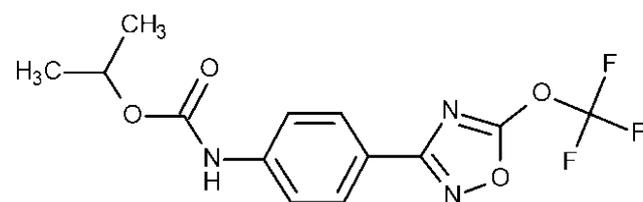
N - [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] プロパンアミド ; 20  
【化6】



N - [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメトキシ ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] アセトアミド ; 30  
【化7】



メチル N - [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメトキシ ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] カルバメート ; および 40  
【化8】



イソプロピル N - [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメトキシ ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] カルバメート 50

である。

【0062】

本発明によらない上記の化合物は、米国特許第4,871,753号明細書から公知である。

【0063】

以下のリストは、本発明に係る式(I)の化合物に関する置換基 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、および $R^9$ についての、好ましい定義を含む定義を提供する。これらの置換基のいずれか1つについて、以下に示される定義のいずれかが、以下または本明細書の他の箇所に示されるいずれかの他の置換基のいずれかの定義と組み合わせられ得る。

【0064】

$A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ は、独立して、NまたはC-Hを表す。好ましくは、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の少なくとも2つは、C-Hである。より好ましくは、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の少なくとも3つは、C-Hであり、ここで、 $A^1$ がNであるとき、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の全ては、C-Hを表し、 $A^4$ がNであるとき、 $A^1$ 、 $A^2$ 、および $A^3$ の全ては、C-Hを表すか、または $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の全ては、C-Hを表す。一実施形態では、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ は、それぞれ独立して、C-Hを表す。

【0065】

式(I)の化合物についての $R^5$ の定義は、式(IA)の化合物に等しく適用される。 $R^5$ は、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{3-4}$ アルキニル、 $C_{3-4}$ アルケニル、 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、または $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキルを表す。好ましくは、 $R^5$ は、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルキルカルボニル、および $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル $C_{1-4}$ アルキルを表す。より好ましくは、 $R^5$ は、水素、メチル、エチル、メトキシ、アセチル、N-tert-ブチルアミノカルボニルメチル、(N-tert-ブチルアミノカルボニル)-1-エチル、および(N-tert-ブチルアミノカルボニル)-1-メチル-1-エチルを表す。さらにより好ましくは、 $R^5$ は、水素、メチル、メトキシ、アセチル、N-tert-ブチルアミノカルボニルメチル、(N-tert-ブチルアミノカルボニル)-1-エチル、および(N-tert-ブチルアミノカルボニル)-1-メチル-1-エチルを表す。最も好ましくは、 $R^5$ は、水素またはメチルである。

【0066】

$R^6$ は、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{3-6}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ フルオロアルキル、 $C_{3-6}$ ハロアルケニル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-4}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニルオキシ $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ フルオロアルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{1-4}$ アルキルアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノカルボニル、 $C_{1-2}$ アルコキシカルボニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルファニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルホニル $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケノキシアミノ、N- $C_{3-6}$ アルケニルオキシ-N- $C_{1-4}$ アルキルアミノ、シアノ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-3}$ アルキル、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-3}$ アルキルアミノ、フェニル、フェニル $C_{1-3}$ アルキル、フェノキシ $C_{1-2}$ アルキル、フェニル $C_{1-3}$ ハロアルキル、フェニル $C_{1-2}$ アルコキシ、フェニル $C_{1-3}$ アルコキシアミノ、フェニルスルファニル $C_{1-3}$ アルキル、ナフチル $C_{2-3}$ アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール $C_{1-3}$ アルキル(ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-3}$ アルキルまたはヘテロシクリルオキシ $C_{1-3}$ アルキル(ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4~6員非芳香族環である)、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリル

10

20

30

40

50

$C_{1-2}$ アルキル（ここで、ヘテロビシクリル部分は、N、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員～11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋二環式環系である）を表し、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている。

#### 【0067】

好ましくは、 $R^6$ は、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{3-5}$ アルキニル、 $C_{1-4}$ フルオロアルキル、 $C_{3-6}$ ハロアルケニル、 $C_{1-2}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-2}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{2-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニルオキシ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{1-3}$ フルオロアルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{1-3}$ アルキルアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-3}$ アルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノカルボニル、 $C_{1-2}$ アルコキシカルボニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルファニル $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルホニル $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニルオキシアミノ、N- $C_{3-6}$ アルケニルオキシ-N- $C_{1-2}$ アルキルアミノ、シアノ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-3}$ アルキル、N- $C_{1-2}$ アルコキシ-N- $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキルアミノ、フェニル、フェニル $C_{1-3}$ アルキル、フェノキシ $C_{1-2}$ アルキル、フェニル $C_{1-2}$ ハロアルキル、フェニル $C_{1-2}$ アルコキシ、フェニル $C_{1-2}$ アルコキシアミノ、フェニルスルファニル $C_{1-2}$ アルキル、ナフチル $C_{2-3}$ アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール $C_{1-3}$ アルキル（ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である）、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-3}$ アルキルまたはヘテロシクリルオキシ $C_{1-3}$ アルキル（ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4～6員非芳香族環である）、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリル $C_{1-2}$ アルキル（ここで、ヘテロビシクリル部分は、N、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員～11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋二環式環系である）を表し、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている。

#### 【0068】

より好ましくは、 $R^6$ は、 $C_{1-5}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{4-5}$ アルキニル、 $C_{1-3}$ フルオロアルキル、 $C_{3-5}$ ハロアルケニル、 $C_{1-2}$ アルコキシ、 $C_{1-3}$ アルコキシ $C_{1-3}$ アルキル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシ $C_{2-4}$ クロロアルキル、メチルカルボニル、メチル

カルボニルオキシメチル、メトキシアミノ、N - メトキシ - N - C<sub>1-2</sub>アルキルアミノ、N - メトキシ - N - メトキシエチルアミノ、メトキシエトキシメチル、メトキシカルボニルC<sub>2-4</sub>アルキル、メチルスルファニルC<sub>3</sub>アルキル、メチルスルホニルメチル、C<sub>3-4</sub>アルケニルオキシアミノ、N - C<sub>3-4</sub>アルケニルオキシ - N - メチルアミノ、シアノメチル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルC<sub>1-2</sub>アルキル、N - メトキシ - N - シクロプロピルメチルアミノ、フェニル、フェニルC<sub>1-2</sub>アルキル、フェノキシC<sub>1-2</sub>アルキル、フェニルハロメチル、ベンジルオキシアミノ、フェニルスルファニルメチル、ナフチルC<sub>2</sub>アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル（ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である）、ヘテロシクリル（ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4～6員非芳香族環である）、ヘテロビシクリル、およびヘテロビシクリルメチル（ここで、ヘテロビシクリル部分は、N、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員～10員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋二環式環系である）を表し、ここで、

10

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>7</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>8</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換されているか；あるいは

20

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、R<sup>7</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつR<sup>8</sup>から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている。

#### 【0069】

さらにより好ましくは、R<sup>6</sup>は、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、ペンチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチルブチル、2 - メチルブチル、2 - エチルブチル、2 - メチルペンチル、ブテン - 3 - イル、ペンテン - 4 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、ペンチン - 4 - イル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、4, 4, 4 - トリフルオロブチル、(E) - 3, 3, 3 - トリフルオロプロペン - 2 - イル、5, 5 - ジフルオロペンテン - 4 - イル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、メトキシメチル、2 - メトキシメチル、N - メトキシ - N - エチル、1 - メトキシエチル、2 - メトキシエチル、メトキシプロピル、エトキシメチル、4 - メトキシブチル、イソプロポキシメチル、3 - メトキシプロピル、2 - (メトキシメチル)ブチル、2 - ヒドロキシエチル、N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)アミノ、N - メトキシアミノ、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - エチル - N - メトキシアミノ、1 - メトキシ - 1 - (2 - メトキシエチル)アミノ、N - メトキシ - N - (2 - メトキシエチル)アミノ、(2 - メトキシエトキシ)メチル、N - tert - ブチルアミノカルボニルメチル、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、メチルスルホニルメチル、N - アリルオキシアミノ、N - アリルオキシ - N - メチルアミノ、N - 2 - メチル - アリルオキシアミノ、シアノメチル、シクロプロピル、1 - メチルシクロプロピル、2 - メチルシクロブチル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、シクロブチル、3 - オキソ - シクロブチル、シクロペンチル、シクロペンテン - 1 - イル、1 - シアノシクロプロピル、2 - メチルシクロプロピル、2, 2 - ジメチルシクロプロピル、3 - メトキシ - 5 - オキソシクロヘキセン - 3 - イル、シクロプロピルメチル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、シクロペンテン - 3 - イル、N - (シクロプロピルメチル) - N - メトキシアミノ、フェニル、2 - クロロフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニ

30

40

50

ル、2 - (トリフルオロメチル)フェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、2 - トリフル  
 オロメチルフェニル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェ  
 ニル、4 - イミダゾール - 1 - イル - フェニル、2 - フェニルエチル、4 - メトキシベン  
 ズル、(4 - メトキシフェニル)メチル、[4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]  
 メチル、[4 - [2 - オキソ - 2 - アニリノ]エチル]フェニルメチル、(3, 4, 5 -  
 トリメトキシフェニル)エチル、4 - エチルカルボニルアミノフェニルメチル、(2 - フ  
 ルオロフェニル)メチル、1 - フェノキシエチル、フェニルフルオロメチル、N - [(2  
 - フルオロフェニル)メトキシ]アミノ、フェニルスルファニルメチル、(3 - ピリジル  
 )メチル、(3 - ピリジル)エチル、(4 - ピリジル)エチル、(2 - チエニル)メチル  
 、3 - メチルオキサタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラ  
 ン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、N - オキサジナン - 2 - イル (N - ox  
 azinan - 2 - yl)、N - モルホリノ 1 - イル、N - ピペラジン - 1 - イル、N -  
 ピロリジン - 1 - イル、チエタン - 3 - イル、テトラヒドロチオピラン - 4 - イル、1,  
 3 - ジオキソラン - 2 - イル、1H - ピラゾール - 4 - イル、3 - メチルオキサタン - 3  
 - イル、(ピラゾール - 1 - イル)メチル、2 - (1 - ピペリジル)エチル、4 - メトキシ  
 - N - ピペラジン - 1 - イル、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、  
 6 - モルホリノピラジン - 2 - イル、3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 -  
 イル、(4, 6 - ジメトキシピリミジン - 5 - イル)メチル、2 - (1, 3 - ベンゾジオ  
 ザール - 5 - イル)プロピル (2 - (1, 3 - benzodiazol - 5 - yl) pr  
 opyl)、(1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)メチル、(2 - オキソ - 2 - エチ  
 ルアセテート)メチル、(3, 3 - ジフルオロシクロブチル)メチル、(3, 5 - ジクロ  
 ロ - 2 - ピリジル) - 1, 1 - ジメチル - メチル、(3, 5 - ジフルオロフェニル)メチ  
 ル、(5 - メチルピラゾール - 1 - イル)メチル、[4 - (トリフルオロメチル) - 2 -  
 ピリジル]メチル、[6 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル]メチル、[6 - (ト  
 リフルオロメチル) - 3 - ピリジル]メチル、2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 -  
 イル)フェニル、イミダゾ [1, 2 - a]ピリジン - 8 - イル、2 - (メトキシメチル)  
 - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イル、N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、および  
 N - (3 - メチルブタ - 2 - エノキシ)アミノから選択される。

【0070】

上記の好ましいリストの一実施形態では、R<sup>6</sup>は、イソプロピル、n - ブチル、イソブ  
 チル、sec - ブチル、ペンチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 -  
 メチルブチル、2 - メチルブチル、2 - エチルブチル、2 - メチルペンチル、ブテン - 3  
 - イル、ペンテン - 4 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、ペンチン - 4 - イル、ジフ  
 ルオロメチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、  
 4, 4, 4 - トリフルオロブチル、(E) - 3, 3, 3 - トリフルオロプロペン - 2 - イ  
 ル、5, 5 - ジフルオロペンテン - 4 - イル、メトキシ、イソプロポキシ、2 - メトキシ  
 メチル、N - メトキシ - N - エチル、1 - メトキシエチル、メトキシプロピル、4 - メト  
 キシブチル、イソプロポキシメチル、2 - (メトキシメチル)ブチル、2 - ヒドロキシエ  
 チル、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - エチル - N - メトキシアミノ、1 - メトキ  
 シ - 1 - (2 - メトキシエチル)アミノ、N - メトキシ - N - (2 - メトキシエチル)ア  
 ミノ、(2 - メトキシエトキシ)メチル、N - tert - ブチルアミノカルボニルメチル  
 、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、メチルスルホニルメチル、N - アリル  
 オキシ - N - メチルアミノ、2 - メチルシクロブチル、1 - フルオロシクロプロピル、2  
 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、3 - オキソ - シクロブ  
 チル、シクロペンテン - 1 - イル、1 - シアノシクロプロピル、2 - メチルシクロプロピ  
 ル、3 - メトキシ - 5 - オキソシクロヘキセン - 3 - イル、2, 2 - ジフルオロシクロブ  
 ロピルメチル、シクロペンテン - 3 - イル、N - (シクロプロピルメチル) - N - メトキ  
 シアミノ、2 - クロロフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、2 - (トリフルオ  
 ロメチル)フェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、  
 2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、4 - イミダゾ

10

20

30

40

50

ール - 1 - イル - フェニル、2 - フェニルエチル、4 - メトキシベンジル、(4 - メトキシフェニル)メチル、[4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル、[4 - [2 - オキソ - 2 - アニリノ]エチル]フェニルメチル、(3, 4, 5 - トリメトキシフェニル)エチル、4 - エチルカルボニルアミノフェニルメチル、(2 - フルオロフェニル)メチル、1 - フェノキシエチル、フェニルフルオロメチル、N - [(2 - フルオロフェニル)メトキシ]アミノ、フェニルスルファニルメチル、(3 - ピリジル)メチル、(3 - ピリジル)エチル、(4 - ピリジル)エチル、(2 - チエニル)メチル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、N - モルホリノ 1 - イル、N - ピペラジン - 1 - イル、N - ピロリジン - 1 - イル、チエタン - 3 - イル、テトラヒドロチオピラン - 4 - イル、1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル、1H - ピラゾール - 4 - イル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、(ピラゾール - 1 - イル)メチル、2 - (1 - ビペリジル)エチル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、6 - モルホリノピラジン - 2 - イル、3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、(4, 6 - ジメトキシピリミジン - 5 - イル)メチル、2 - (1, 3 - ベンゾジオゾール - 5 - イル)プロピル、(1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)メチル、(2 - オキソ - 2 - エチルアセテート)メチル、(3, 3 - ジフルオロシクロブチル)メチル、(3, 5 - ジクロロ - 2 - ピリジル) - 1, 1 - ジメチル - メチル、(3, 5 - ジフルオロフェニル)メチル、(5 - メチルピラゾール - 1 - イル)メチル、[4 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル]メチル、[6 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル]メチル、[6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル]メチル、2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル)フェニル、イミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 8 - イル、2 - (メトキシメチル) - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イル、N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、および N - (3 - メチルブタ - 2 - エノキシ)アミノから選択される。

【0071】

さらにより好ましくは、R<sup>6</sup>は、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、エトキシ、メトキシメチル、2 - メトキシエチル、メトキシプロピル、N - メトキシアミノ、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - アリルオキシアミノ、N - アリルオキシ - N - メチルアミノ、N - 2 - メチルアリルオキシアミノ、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、1 - メトキシ - 1 - (2 - メトキシエチル)アミノ、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、1 - メチルシクロプロピル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、2 - メチルシクロブチル、1 - シアノシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンテン - 1 - イル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、2 - クロロフェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、N - オキサジナン - 2 - イル、6 - モルホリノピラジン - 2 - イル、4 - プロパンアミドフェニルメチル、3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、(4, 6 - ジメトキシピリミジン - 5 - イル)メチル、および 2 - (1, 3 - ベンゾジオゾール - 5 - イル)プロピルを表す。

【0072】

上記のより好ましいリストの一実施形態では、R<sup>6</sup>は、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - 2 - メチルアリルオキシアミノ、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチ

10

20

30

40

50

ル、1 - メトキシ - 1 - (2 - メトキシエチル) アミノ、1 - フルオロシクロプロピル、  
2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロ  
シクロプロピルメチル、2 - メチルシクロブチル、シクロペンテン - 1 - イル、3 - メチ  
ルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イ  
ル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、2 - クロロフェニル、2 - トリフルオロメチルフェ  
ニル、4 - メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、2 - (N - イソプロピル  
アミノカルボニル) - 3 - (フルオロ) フェニル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 -  
イル、6 - モルホリノピラジン - 2 - イル、4 - プロパンアミドフェニルメチル、3 - メ  
トキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、(4, 6 - ジメトキシピリミジン - 5  
- イル) メチル、および 2 - (1, 3 - ベンゾジオゾール - 5 - イル) プロピルを表す。

10

## 【0073】

さらにより好ましくは、R<sup>6</sup>は、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n -  
ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、  
3 - メチル - ブチン - 3 - イル、N - アリルオキシアミノ、メトキシメチル、N - メトキ  
シアミノ、N - エチル - N - メトキシアミノ、N - 2 - メチルアリルオキシアミノ、N -  
アリルオキシ - N - メチルアミノ、N - メトキシ - N - (2 - メトキシエチル) アミノ、  
N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ) アミノ、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジ  
メチルエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、  
2 - メトキシエチル、シクロプロピル、1 - メチルシクロプロピル、2 - メチルシクロブ  
ロピル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオ  
ロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、1 - シアノシクロプロピ  
ル、シクロブチル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、  
テトラヒドロピラン - 2 - イル、シクロペンテン - 1 - イル、2 - (N - イソプロピルア  
ミノカルボニル) - 3 - (フルオロ) フェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 -  
メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1  
- イル、N - オキサジナン - 2 - イル、6 - モルホリノピラジン - 2 - イル、3 - メトキ  
シ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、(4, 6 - ジメトキシピリミジン - 5 - イ  
ル) メチル、および 2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) フェニルを表す。

20

## 【0074】

上記のさらにより好ましいリストの一実施形態では、R<sup>6</sup>は、イソプロピル、n - ブチ  
ル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 -  
メチル - ブチン - 3 - イル、N - エチル - N - メトキシアミノ、N - 2 - メチルアリルオ  
キシアミノ、N - メトキシ - N - (2 - メトキシエチル) アミノ、N - メチル - N - (2  
- メチルアリルオキシ) アミノ、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、2, 2  
, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、2 - メチルシクロブ  
ロピル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオ  
ロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、3 - メチルオキセタン - 3  
- イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、シクロペンテ  
ン - 1 - イル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ) フェニル  
、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメ  
チル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、6 - モルホリノピラジン - 2 - イル、  
3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、(4, 6 - ジメトキシピリミジ  
ン - 5 - イル) メチル、および 2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) フェニル  
を表す。

30

40

## 【0075】

さらにさらにより好ましくは、R<sup>6</sup>は、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イ  
ソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチル  
- ブチン - 3 - イル、N - アリルオキシアミノ、N - エチル - N - メトキシアミノ、N -  
2 - メチルアリルオキシアミノ、N - アリルオキシ - N - メチルアミノ、N - メトキシ -  
N - (2 - メトキシエチル) アミノ、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ) アミ

50

ノメトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、2 - メトキシエチル、シクロプロピル、1 - メチルシクロプロピル、2 - メチルシクロプロピル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、1 - シアノシクロプロピル、シクロブチル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、シクロペンテン - 1 - イル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - メトキシフェニルメチル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、N - オキサジナン - 2 - イル、および 2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル)フェニルを表す。

【0076】

上記のさらにより好ましいリストの一実施形態では、 $R^6$ は、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチル - ブチン - 3 - イル、N - エチル - N - メトキシアミノ、N - 2 - メチルアリルオキシアミノ、N - メトキシ - N - (2 - メトキシエチル)アミノ、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノメトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、2 - メチルシクロプロピル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、シクロペンテン - 1 - イル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - メトキシフェニルメチル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、および 2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル)フェニルを表す。

【0077】

$R^7$ は、シアノ、ハロゲン、メチル、エチル、イソプロピル、t - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、シクロプロピル、 $C_{1-4}$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、ジ -  $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ  $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニルカルボニルアミノを表し；  
あるいは、 $R^6$ が、シクロアルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロピシクリルであるとき、 $R^7$ は、オキソ (= O) を表してもよい。

【0078】

$R^8$ は、フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニルアミノ、モルホリニル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーールオキシ、ヘテロアリーールカルボニルアミノ（ここで、ヘテロアリーール部分は、N、O および S から独立して選択される 1 個、2 個、3 個もしくは 4 個のヘテロ原子を含む 5 員もしくは 6 員芳香族環である）、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ、ベンジルオキシカルボニルアミノを表し、ここで、前記フェニル、モルホリニル、またはヘテロアリーール部分のいずれかは、 $R^9$ から選択される、同じもしくは異なり得る 1 個、2 個もしくは 3 個の置換基で任意選択により置換されている。

【0079】

$R^9$ は、メチル、エチル、イソプロピル、t - ブチル、メトキシ、エトキシ、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シアノ、およびアミノを表す。

【0080】

好ましくは、式 (I) による化合物は、表 T 1 (以下) に列挙されている化合物 1. 1 ~ 1. 143、または表 T 2 (以下) に列挙されている 2. 1 ~ 2. 30 から選択される。

【0081】

好ましくは、本発明の式 (I) による化合物において、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$  および  $A^4$  の全ては、C - H を表し；

10

20

30

40

50

R<sup>5</sup>は、H、メチルまたはメトキシを表し；

R<sup>6</sup>は、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、n-ペンタ-2-イル、n-ペンタ-3-イル、3-メチルブチン-3-イル、エトキシ、N-アリルオキシアミノ、メトキシメチル、2-メトキシエチル、メトキシプロピル、1-メトキシ-1-(2-メトキシエチル)アミノ、N-メトキシアミノ、N-メチル-N-メトキシアミノ、N-2-メチルアリルオキシアミノ、N-メチル-N-(2-メチルアリルオキシ)アミノ、N-アリルオキシ-N-メチルアミノ、メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、2-メトキシエチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、1-メチルシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、2-メチルシクロブチル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、3-メチルオキセタン-3-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロピラン-2-イル、シクロペンテン-1-イル、2-(N-イソプロピルアミノカルボニル)-3-(フルオロ)フェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、2-クロロフェニル、4-メトキシ-N-ピペラジン-1-イル、N-オキサジナン-2-イル、6-モルホリノピラジン-2-イル、4-エチルカルボニルアミノフェニルメチル、3-メトキシ-5-オキソ-シクロヘキセン-3-イル、(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)メチル、または2-(1,3-ベンゾジオゾール-5-イル)プロピルである。

10

20

【0082】

より好ましくは、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>の全ては、C-Hを表し；

R<sup>5</sup>は、Hまたはメチルを表し；

R<sup>6</sup>は、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、n-ペンタ-2-イル、n-ペンタ-3-イル、3-メチル-ブチン-3-イル、N-アリルオキシアミノ、メトキシメチル、N-メトキシアミノ、N-エチル-N-メトキシアミノ、N-2-メチルアリルオキシアミノ、N-アリルオキシ-N-メチルアミノ、N-メトキシ-N-(2-メトキシエチル)アミノ、N-メチル-N-(2-メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、2-メトキシエチル、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、3-メチルオキセタン-3-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロピラン-2-イル、シクロペンテン-1-イル、2-(N-イソプロピルアミノカルボニル)-3-(フルオロ)フェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、4-メトキシ-N-ピペラジン-1-イル、N-オキサジナン-2-イル、6-モルホリノピラジン-2-イル、3-メトキシ-5-オキソ-シクロヘキセン-3-イル、(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)メチル、および2-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)フェニルである。

30

40

【0083】

さらにより好ましくは、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>の全ては、C-Hを表し；

R<sup>5</sup>は、Hを表し；

R<sup>6</sup>は、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、n-ペンタ-2-イル、n-ペンタ-3-イル、3-メチル-ブチン-3-イル、N-アリルオキシアミノ、N-エチル-N-メトキシアミノ、N-2-メチルアリルオキシアミノ、N-アリルオキシ-N-メチルアミノ、N-メトキシ-N-(2-メトキシエチル)アミノ、N-メチル-N-(2-メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、2-メトキシエチル、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロ

50

プロピル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、1 - シアノシクロプロピル、シクロブチル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、シクロペンテン - 1 - イル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - メトキシフェニルメチル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、N - オキサジナン - 2 - イル、および 2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル)フェニルである。

【0084】

—実施形態では、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の全ては、C - Hを表し；

$R^5$ は、Hを表し；

$R^6$ は、エチル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、エトキシ、1 - メトキシ - 1 - (2 - メトキシエチル)アミノ、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - 2 - メチルアリルオキシアミノ、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、2 - メトキシエチル、シクロプロピルメチル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、2 - メチルシクロブチル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、シクロペンテン - 1 - イル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、2 - クロロフェニル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、6 - モルホリノピラジン - 2 - イル、4 - エチルカルボニルアミノフェニルメチル、3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、(4, 6 - ジメトキシピリミジン - 5 - イル)メチル、または 2 - (1, 3 - ベンゾジオゾール - 5 - イル)プロピルである。

【0085】

別の実施形態では、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の全ては、C - Hを表し；

$R^5$ は、メチルを表し；

$R^6$ は、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、N - アリルオキシアミノ、メトキシメチル、2 - メトキシエチル、メトキシプロピル、1 - メトキシ - 1 - (2 - メトキシエチル)アミノ、N - メトキシアミノ、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - 2 - メチルアリルオキシアミノ、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、N - アリルオキシ - N - メチルアミノ、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、2 - メトキシエチル、シクロプロピル、1 - メチルシクロプロピル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、2 - メチルシクロブチル、1 - シアノシクロプロピル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、シクロペンテン - 1 - イル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、2 - クロロフェニル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、N - オキサジナン - 2 - イル、6 - モルホリノピラジン - 2 - イル、4 - エチルカルボニルアミノフェニルメチル、3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、(4, 6 - ジメトキシピリミジン - 5 - イル)メチル、または 2 - (1, 3 - ベンゾジオゾール - 5 - イル)プロピルである。

【0086】

さらなる実施形態では、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $A^4$ の全ては、C - Hを表し；

$R^5$ は、メトキシを表し；

R<sup>6</sup>は、メチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、n-ペンタ-2-イル、n-ペンタ-3-イル、3-メチルブチン-3-イル、N-アリルオキシアミノ、メトキシメチル、2-メトキシエチル、メトキシプロピル、1-メトキシ-1-(2-メトキシエチル)アミノ、N-メトキシアミノ、N-メチル-N-メトキシアミノ、N-2-メチルアリルオキシアミノ、N-メチル-N-(2-メチルアリルオキシ)アミノ、N-アリルオキシ-N-メチルアミノ、メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、2-メトキシエチル、シクロプロピルメチル、1-メチルシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、2-メチルシクロブチル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、3-メチルオキサタン-3-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロピラン-2-イル、シクロペンテン-1-イル、2-(N-イソプロピルアミノカルボニル)-3-(フルオロ)フェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニルメチル、フェニルフルオロメチル、2-クロロフェニル、4-メトキシ-N-ピペラジン-1-イル、N-オキサジナン-2-イル、6-ホルリノピラジン-2-イル、4-エチルカルボニルアミノフェニルメチル、3-メトキシ-5-オキソ-シクロヘキセン-3-イル、(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)メチル、または2-(1,3-ベンゾジオゾール-5-イル)プロピルである。

10

20

## 【0087】

下記のリストは、本発明による式(IA)の化合物に関連して、置換基A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、およびR<sup>9</sup>についての好ましい定義を含めた定義を提供する。これらの置換基の任意の1つについて、下記で示す定義のいずれかは、本明細書において下記またはその他の場所に示した任意の他の置換基の任意の定義と合わせ得る。

## 【0088】

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>は、独立して、NまたはC-Hを表し、ここで、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>の少なくとも3つは、C-Hであり；ここで、A<sup>1</sup>がNであるとき、A<sup>2</sup>~A<sup>4</sup>の全ては、C-Hを表し、A<sup>4</sup>がNであるとき、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、およびA<sup>3</sup>の全ては、C-Hを表す。一実施形態では、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>およびA<sup>4</sup>は、それぞれ独立して、C-Hを表す。

30

## 【0089】

R<sup>5</sup>は、上記の式(I)の化合物について定義した通りである。

## 【0090】

R<sup>6</sup>は、C<sub>3-6</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニル、C<sub>3-6</sub>アルキニル、C<sub>2-4</sub>フルオロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキル、ヒドロキシC<sub>1-4</sub>アルキル、ヒドロキシC<sub>1-4</sub>ハロアルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルキルカルボニルオキシC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>フルオロアルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノ、N-C<sub>2-4</sub>アルキル-N-C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノ、N-C<sub>1-2</sub>アルコキシ-N-C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-2</sub>アルコキシC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルコキシアミノカルボニル、C<sub>1-2</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルファニルC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-2</sub>アルキルスルホニルC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシアミノ、N-C<sub>3-6</sub>アルケニルオキシ-N-C<sub>1-4</sub>アルキルアミノ、シアノC<sub>1-2</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-3</sub>アルキル、N-C<sub>1-2</sub>アルコキシ-N-C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-3</sub>アルキルアミノ、フェニル、フェニルC<sub>1-3</sub>アルキル、フェノキシC<sub>1-2</sub>アルキル、フェニルC<sub>1-3</sub>ハロアルキル、フェニルC<sub>1-2</sub>アルコキシ、フェニルC<sub>1-3</sub>アルコキシアミノ、フェニルスルファニルC<sub>1-3</sub>アルキル、ナフチルC<sub>2-3</sub>アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル(ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルC<sub>1-3</sub>アルキルまたはヘテロシクリルオキシC<sub>1-3</sub>アルキル(ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4~6員非芳香族環で

40

50

あり、ヘテロシクリル部分が、窒素原子を含有するとき、ヘテロシクリルは、窒素原子によって分子の残部に接続している)、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリル $C_{1-2}$ アルキル(ここで、ヘテロビシクリル部分は、OおよびSから選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む7員~11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋環系である)であり、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意選択により置換されているか;あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換されているか;あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている。

【0091】

好ましくは、 $R^6$ は、 $C_{3-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{3-6}$ アルキニル、 $C_{2-4}$ フルオロアルキル、 $C_{1-3}$ アルコキシ $C_{1-3}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-3}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{2-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-2}$ アルキルカルボニルオキシ $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ フルオロアルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ- $C_{2-3}$ アルキルアミノ、N- $C_{1-2}$ アルコキシ- $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-4}$ アルキルアミノ、 $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルコキシ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノカルボニル、 $C_{1-2}$ アルコキシカルボニル $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルファニル $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルキルスルホニル $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-5}$ アルケニルオキシアミノ、N- $C_{3-5}$ アルケニルオキシ- $C_{1-3}$ アルキルアミノ、シアノ $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキル、N- $C_{1-2}$ アルコキシ- $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキルアミノ、フェニル、フェニル $C_{1-3}$ アルキル、フェノキシ $C_{1-2}$ アルキル、フェニル $C_{1-2}$ ハロアルキル、フェニル $C_{1-2}$ アルコキシ、フェニル $C_{1-3}$ アルコキシアミノ、フェニルスルファニル $C_{1-2}$ アルキル、ナフチル $C_{2-3}$ アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール $C_{1-3}$ アルキル(ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-3}$ アルキルまたはヘテロシクリルオキシ $C_{1-3}$ アルキル(ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4~6員非芳香族環であり、ヘテロシクリル部分が、窒素原子を含有するとき、ヘテロシクリルは、窒素原子によって分子の残部に接続している)、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリル $C_{1-2}$ アルキル(ここで、ヘテロビシクリル部分は、OおよびSから選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む7員~11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋環系である)を表し、ここで、

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意選択により置換されているか;あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換されているか;あるいは

前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている。

【0092】

10

20

30

40

50

より好ましくは、 $R^6$ は、 $C_{3-5}$ アルキル、 $C_{3-6}$ アルケニル、 $C_{4-5}$ アルキニル、 $C_{2-3}$ フルオロアルキル、 $C_{1-3}$ アルコキシ $C_{1-3}$ アルキル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシ $C_{2-4}$ クロロアルキル、メチルカルボニル、メチルカルボニルオキシメチル、メトキシアミノ、 $N$ -メトキシ- $N$ - $C_{2-3}$ アルキルアミノ、 $N$ -メトキシ- $N$ -メトキシエチルアミノ、メトキシエトキシメチル、 $C_{1-2}$ アルコキシアミノカルボニル、メトキシカルボニル $C_{2-4}$ アルキル、メチルスルファニル $C_3$ アルキル、メチルスルホニルメチル、 $C_{3-4}$ アルケニルオキシアミノ、 $N$ - $C_{3-4}$ アルケニルオキシ- $N$ -メチルアミノ、シアノメチル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル $C_{1-2}$ アルキル、 $N$ -メトキシ- $N$ - $C_{3-6}$ シクロプロピルメチルアミノ、フェニル、フェニル $C_{1-2}$ アルキル、フェノキシ $C_{1-2}$ アルキル、フェニルハロメチル、フェニル $C_{1-2}$ アルコキシ、ベンジルオキシアミノ、フェニルスルファニルメチル、ナフチル $C_2$ アルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリール $C_{1-3}$ アルキル(ここで、ヘテロアリール部分は、 $N$ 、 $O$ および $S$ から独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である)、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-3}$ アルキルまたはヘテロシクリルオキシ $C_{1-3}$ アルキル(ここで、ヘテロシクリル部分は、 $N$ 、 $O$ および $S$ から独立して選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分飽和の4~6員非芳香族環であり、ヘテロシクリル部分が、窒素原子を含有するとき、ヘテロシクリルは、窒素原子によって分子の残部に接続している)、ヘテロビシクリル、ヘテロビシクリル $C_{1-2}$ アルキル(ここで、ヘテロビシクリル部分は、 $O$ および $S$ から選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子を含む7員~11員飽和もしくは部分飽和の縮合もしくは架橋環系である)を表し、ここで、前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個、2個、3個もしくは4個の置換基で任意選択により置換されているか;あるいは前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換されているか;あるいは前記シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたはヘテロビシクリル部分のいずれかは、 $R^7$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基で置換されており、かつ $R^8$ から選択される、同じもしくは異なり得る1個もしくは2個の置換基でさらに置換されている。

10

20

30

40

50

【0093】

さらにより好ましくは、 $R^6$ は、 $n$ -プロピル、イソプロピル、 $n$ -ブチル、イソブチル、 $sec$ -ブチル、 $n$ -ペンタ-2-イル、 $n$ -ペンタ-3-イル、3-メチルブチン-3-イル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、メトキシメチル、1-メトキシエチル、2-メトキシエチル、メトキシプロピル、 $N$ -アリルオキシアミノ、2,2-ジフルオロシクロプロピル、2-クロロフェニル、3-メチルオキサタン-3-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロピラン-2-イル、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロブチル、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、1-シアノシクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチル、シクロペンテン-1-イル、2-( $N$ -イソプロピルアミノカルボニル)-3-(フルオロ)フェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシベンジル、フェニルフルオロメチル、メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル、 $N$ -メチル- $N$ -メトキシアミノ、 $N$ -2-メチルアリルオキシアミノ、4-メトキシ- $N$ -ピペラジン-1-イル、 $N$ -メチル- $N$ -(2-メチルアリルオキシ)アミノ、 $N$ -アリルオキシ- $N$ -メチルアミノ、 $N$ -オキサジナン-2-イル、 $N$ -メトキシアミノ、4-エチルカルボニルアミノフェニルメチル、3-メトキシ-5-オキソ-シクロヘキセン-3-イル、2-(1,3-ベンゾジオゾール-5-イル)プロピル、(1,2,4-トリアゾール-1-イル)メチル、(2-フルオロフェニル)メチル、(2-メトキシエトキシ)メチル、(2-オキソ-2-エチルアセテート)メチル、(2-チエニル)メチル、(3

、 3 - ジフルオロシクロブチル)メチル、( 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル)エチル、( 3 , 5 - ジフルオロフェニル)メチル、( 4 - メトキシフェニル)メチル、( 5 - メチルピラゾール - 1 - イル)メチル、(ピラゾール - 1 - イル)メチル、[ 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル、[ 4 - [ 2 - オキソ - 2 - アニリノ]エチル]フェニルメチル、1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル、1 - シアノシクロプロピル、1 - フェノキシエチル、2 - ( 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル)フェニル、2 - フェニルエチル、3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル、3 , 4 - ジメトキシフェニル、3 - メトキシ - 5 - オキソシクロヘキセン - 3 - イル、3 - メトキシプロピル、3 - メチルブチル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、3 - オキソ - シクロブチル、4 , 4 , 4 - トリフルオロブチル、4 - イミダゾール - 1 - イル - フェニル、ブテン - 3 - イル、シアノメチル、シクロペンテン - 3 - イル、シクロペンチル、エトキシメチル、イソプロポキシメチル、2 - ( 1 - ピペリジル)エチル、2 - (メトキシメチル) - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イル、2 - (メトキシメチル)ブチル、2 - (トリフルオロメチル)フェニル、2 , 2 - ジフルオロシクロプロピル、2 , 2 - ジメチルシクロプロピル、N - tert - ブチルアミノカルボニルメチル、2 - エチルブチル、2 - ヒドロキシエチル、2 - メトキシメチル、2 - メチルブチル、2 - メチルシクロプロピル、2 - メチルペンチル、メチルスルホニル - メチル、N - (シクロプロピルメチル) - N - メトキシアミノ、チエタン - 3 - イル、ペンテン - 4 - イル、ペンチル、ペンチン - 4 - イル、フェニル、フェニルスルファニルメチル、テトラヒドロチオピラン - 4 - イル、トリフルオロメチル、N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル)アミノ、N - ( 2 - メチルアリルオキシ)アミノ、N - ( 3 - メチルブタ - 2 - エノキシ)アミノ、N - [ ( 2 - フルオロフェニル)メトキシ]アミノ、N - エチル - N - メトキシアミノ、N - メトキシ - N - ( 2 - メトキシエチル)アミノ、N - メトキシ - N - エチル、N - ピロリジン - 1 - イル、N - ピペラジン - 1 - イル、および N - モルホリノ - 1 - イルを表す。

【 0 0 9 4 】

上記のより好ましいリストの一実施形態では、R<sup>6</sup>は、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル、3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピル、1 - メトキシエチル、2 , 2 - ジフルオロシクロプロピル、2 - クロロフェニル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、2 - メチルシクロブチル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2 , 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、シクロペンテン - 1 - イル、2 - ( N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - メトキシベンジル、フェニルフルオロメチル、メトキシカルボニル - 2 , 2 - ジメチルエチル、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - 2 - メチルアリルオキシアミノ、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、N - メチル - N - ( 2 - メチルアリルオキシ)アミノ、4 - エチルカルボニルアミノフェニルメチル、3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、2 - ( 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル)プロピル、( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル)メチル、( 2 - フルオロフェニル)メチル、( 2 - メトキシエトキシ)メチル、( 2 - オキソ - 2 - エチルアセテート)メチル、( 2 - チエニル)メチル、( 3 , 3 - ジフルオロシクロブチル)メチル、( 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル)エチル、( 3 , 5 - ジフルオロフェニル)メチル、( 4 - メトキシフェニル)メチル、( 5 - メチルピラゾール - 1 - イル)メチル、(ピラゾール - 1 - イル)メチル、[ 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル、[ 4 - [ 2 - オキソ - 2 - アニリノ]エチル]フェニルメチル、1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル、1 - シアノシクロプロピル、1 - フェノキシエチル、2 - ( 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル)フェニル、2 - フェニルエチル、3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル、3 , 4 - ジメトキシフェニル、3 - メトキシ - 5 - オキソシクロヘキセン - 3 - イル、3 - メトキシプロピル、3 - メチルブチル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、3 - オキソ - シクロブチル、4 , 4 , 4 - トリフルオロブチル、4 - イミダゾ

ール - 1 - イル - フェニル、ブテン - 3 - イル、イソプロポキシメチル、2 - (1 - ピペリジル)エチル、2 - (メトキシメチル) - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イル、2 - (メトキシメチル)ブチル、2 - (トリフルオロメチル)フェニル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、N - tert - ブチルアミノカルボニルメチル、2 - エチルブチル、2 - ヒドロキシエチル、2 - メチルブチル、2 - メチルシクロプロピル、2 - メチルペンチル、メチルスルホニル - メチル、N - (シクロプロピルメチル) - N - メトキシアミノ、チエタン - 3 - イル、ペンテン - 4 - イル、ペンチル、ペンチン - 4 - イル、フェニルスルファニルメチル、テトラヒドロチオピラン - 4 - イル、N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)アミノ、N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、N - (3 - メチルブタ - 2 - エノキシ)アミノ、N - [(2 - フルオロフェニル)メトキシ]アミノ、N - エチル - N - メトキシアミノ、N - メトキシ - N - (2 - メトキシエチル)アミノ、N - メトキシ - N - エチル、N - ピロリジン - 1 - イル、N - ピペラジン - 1 - イル、およびN - モルホリノ - 1 - イルを表す。

【0095】

さらにより好ましくは、 $R^6$ は、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、エトキシ、メトキシメチル、2 - メトキシエチル、メトキシプロピル、N - メトキシアミノ、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - アリルオキシアミノ、N - アリルオキシ - N - メチルアミノ、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、1 - メチルシクロプロピル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、2 - メチルシクロブチル、1 - シアノシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンテン - 1 - イル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、2 - クロロフェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、フェニルフルオロメチル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、N - オキサジナン - 2 - イル、3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、および2 - (1, 3 - ベンゾジオゾール - 5 - イル)プロピルを表す。

【0096】

上記のさらにより好ましいリストの一実施形態では、 $R^6$ は、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、n - ペンタ - 2 - イル、n - ペンタ - 3 - イル、3 - メチルブチン - 3 - イル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、2 - メトキシエチル、N - メチル - N - メトキシアミノ、N - アリルオキシ - N - メチルアミノ、N - メチル - N - (2 - メチルアリルオキシ)アミノ、メトキシカルボニル - 2, 2 - ジメチルエチル、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル、2 - メチルシクロブチル、シクロペンテン - 1 - イル、3 - メチルオキセタン - 3 - イル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、2 - クロロフェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、フェニルフルオロメチル、2 - (N - イソプロピルアミノカルボニル) - 3 - (フルオロ)フェニル、4 - メトキシ - N - ピペラジン - 1 - イル、3 - メトキシ - 5 - オキソ - シクロヘキセン - 3 - イル、および2 - (1, 3 - ベンゾジオゾール - 5 - イル)プロピルを表す。

【0097】

$R^7$ は、メチル、エチル、イソプロピル、t - ブチル、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニルアミノ、シアノ、シクロプロピル、 $C_{1-4}$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、ジ -  $C_{1-4}$ アルキルアミノカルボニル、 $C_{1-4}$ アルコキシカルボニルアミノ、 $C_{1-4}$ アルキル、および $C_2$ 。

10

20

30

40

50

6 アルケニルカルボニルアミノを表す。

【0098】

R<sup>8</sup>は、モルホリニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロシクリルカルボニルアミノ（ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1個、2個、3個もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員芳香族環である）、C<sub>1-4</sub>アルコシカルボニルアミノ、ベンジルオキシカルボニルアミノを表し、ここで、前記シクロプロピル、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分のいずれかは、R<sup>8</sup>から選択される同じもしくは異なり得る1個、2個もしくは3個の置換基で任意選択により置換されている。

【0099】

R<sup>9</sup>は、メチル、エチル、イソプロピル、t-ブチル、ハロゲン、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノ、およびアミノを表す。

【0100】

好ましくは、式(I A)による化合物は、表T1(以下)に列挙されている化合物1.1~1.143、または表T2(以下)に列挙されている2.1~2.30から選択される。

【0101】

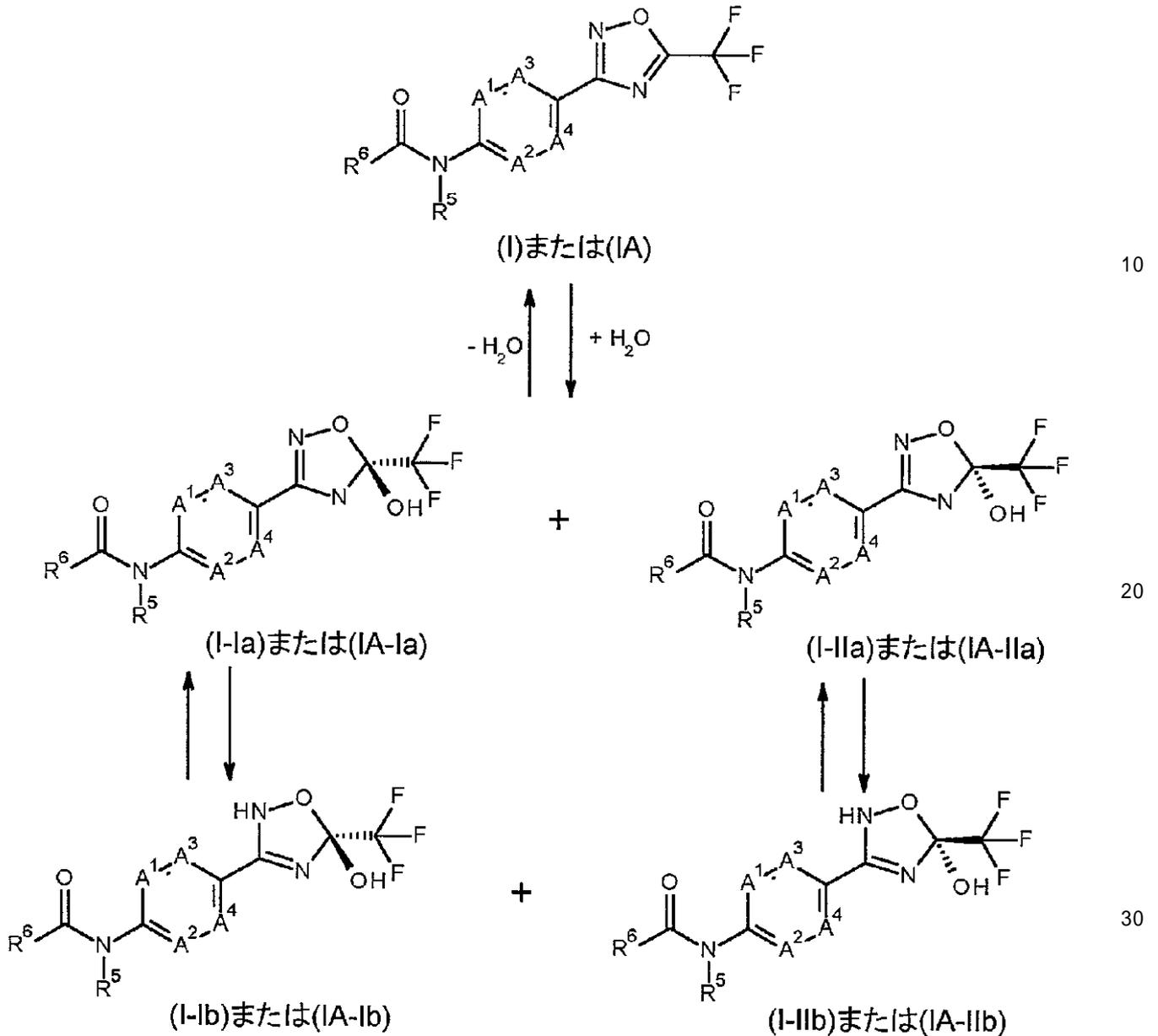
水性媒体中にあるとき、本発明による式(I)および(I A)の化合物は、CF<sub>3</sub>-オキサジアゾールモチーフにおいて、対応する共有結合的に水和した形態(すなわち、下記に示すような式(I-I a)または式(I A-I a)および式(I-I I a)または(I A-I I a)の化合物であって、これらは、式(I-I b)または式(I A-I b)および式(I-I I b)または(I A-I I b)の化合物として互変異性形態で存在し得る)と可逆的平衡状態で存在し得ることが理解される。この動的平衡は、式(I)および式(I A)の化合物の生物活性のために重要であり得る。A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、およびR<sup>9</sup>の表示は、本発明の式(I)および式(I A)の化合物に関して、式(I-I a)、式(I A-I a)、式(I-I b)または式(I A-I b)、および式(I-I I b)、式(I A-I I b)、式(I-I I b)または式(I A-I I b)の化合物、ならびに表1.1A~1.4A、および1.1B~1.4B(以下)において表されているような、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、およびR<sup>9</sup>の組合せの特定の開示、または表T1(以下)に記載されている化合物1.1~1.143、または表T2(以下)に記載されている2.1~2.30に一般に適用される。

10

20

30

【化9】



【0102】

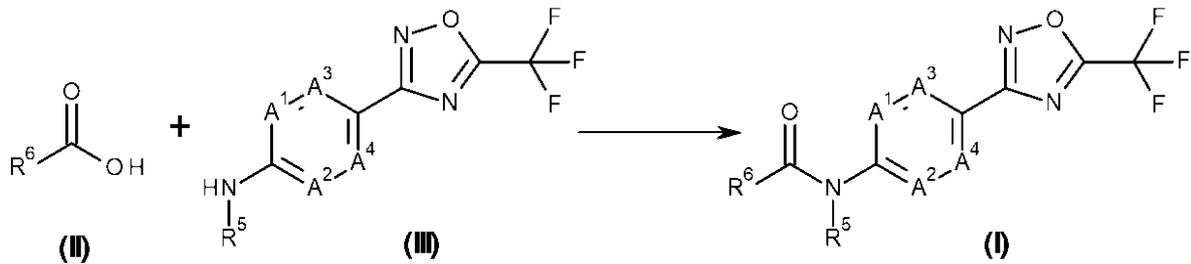
本発明の化合物は、下記のスキームにおいて示されているように作製することができ、ここで、他に記述しない限り、各可変要素の定義は、式(I)または(IA)の化合物について上記で定義されている通りである。

【0103】

式(I)および(IA)の化合物は、式(II)の化合物のカルボン酸官能基を活性化することによって、式(II)の化合物および式(III)の化合物とのアミドカップリング変換によって得ることができ、このプロセスは、好ましくは、適切な溶媒(例えば、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタンまたはテトラヒドロフラン)中、好ましくは、25 ~ 100 の温度で、および任意選択により塩基、例えば、トリエチルアミンもしくはN,N-ジイソプロピルエチルアミンの存在下で、またはアミドカップリングについて文献に記載されている条件下での式(III)の化合物による処理の前に、例えば、(COCl)<sub>2</sub>もしくはSOCl<sub>2</sub>を使用することによって、カルボン酸の-OHを良好な脱離基、例えば、塩化物基へと変換することによって通常行われる。これを、下記のスキーム1において示す。例について、Valeur, E.; Bradley, M. Chem. Soc. Rev. (2009), 38, 606およびChinchilla, R., Naj 40 50

era, C. Chem. Soc. Rev. (2011), 40, 5084を参照されたい。  
式 (I I) の化合物は市販されている。

【化10】



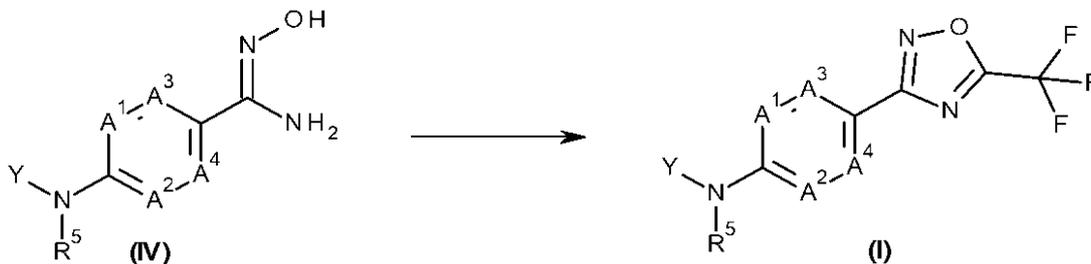
10

スキーム 1

【0104】

代わりに、式 (I) の化合物 (式中、Y は、H または C (=O) R<sup>6</sup> を表す) は、塩基 (例えば、ピリジンまたは 4 - ジメチルアミノピリジン) の存在下で、適切な溶媒、例えば、テトラヒドロフランまたはエタノール中、25 ~ 75 の温度で、トリフルオロ酢酸無水物による処理によって式 (I V) の化合物から調製することができる。関連する例について、国際公開第 2003 / 028729 号および国際公開第 2010 / 045251 号を参照されたい。この反応を、下記のスキーム 2 において示す。

【化11】



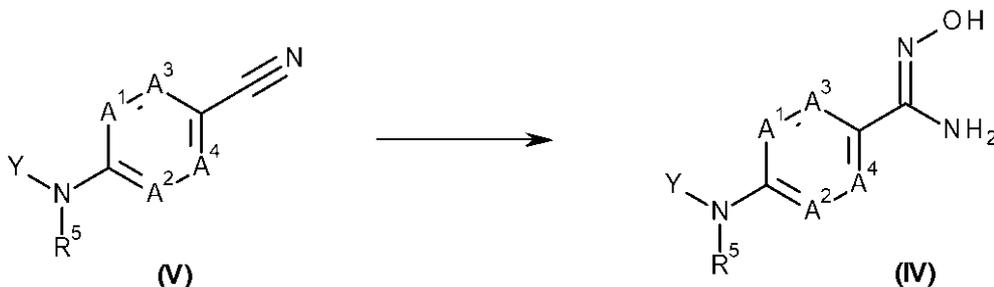
20

スキーム 2

【0105】

式 (I V) の化合物 (式中、Y は、H または C (=O) R<sup>6</sup> を表す) は、塩基、例えば、トリエチルアミンの存在下で、適切な溶媒、例えば、メタノール中、0 ~ 100 の温度で、ヒドロキシアミン塩酸塩による処置によって式 (V) の化合物から調製することができる。関連する例について、Kitamura, S. et al Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268 および国際公開第 2013 / 066838 号を参照されたい。この反応を、スキーム 3 において示す。

【化12】



40

スキーム 3

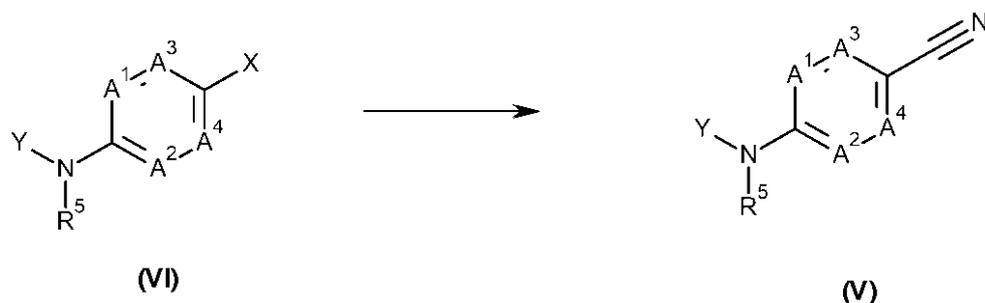
【0106】

さらに、式 (V) の化合物は、適切な溶媒 (例えば、ジメチルホルムアミドまたは N - メチルピロリドン) 中、100 ~ 120 の温度で、適切なシアン化物試薬、例えば、Pd (0) / Zn (CN)<sub>2</sub> または CuCN との金属促進反応を介して、式 (V I) の化

50

合物（式中、Xは、BrまたはIである）から調製することができる。関連する例について、米国特許出願公開第2007/0155739号明細書および国際公開第2009/022746号を参照されたい。この反応を、スキーム4において示す。

【化13】



スキーム4

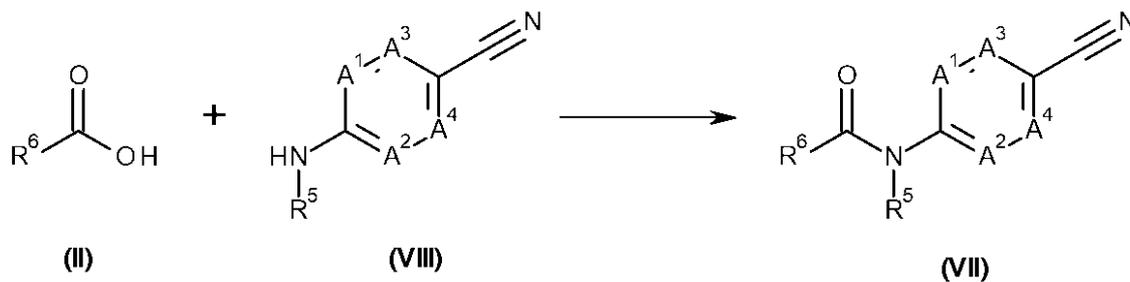
10

【0107】

式(VII)の化合物は、式(II)の化合物のカルボン酸官能基を活性化することによって、式(II)の化合物および式(VIII)の化合物とのアミドカップリング変換によって得ることができ、このプロセスは、好ましくは、適切な溶媒（例えば、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタンまたはテトラヒドロフラン）中、好ましくは、25 ~ 100の温度で、および任意選択により塩基、例えば、トリエチルアミンもしくはN,N-ジイソプロピルエチルアミンの存在下で、またはアミドカップリングについて文献に記載されている条件下での式(VIII)の化合物による処理の前に、例えば、(COCl)<sub>2</sub>もしくはSOCl<sub>2</sub>を使用することによって、カルボン酸の-OHを良好な脱離基、例えば、塩化物基へと変換することによって通常行われる。これを下記のスキーム5において示す。例について、Valeur, E.; Bradley, M. Chem. Soc. Rev. (2009), 38, 606およびChinchilla, R., Najera, C. Chem. Soc. Rev. (2011), 40, 5084を参照されたい。式(II)の化合物および式(VIII)の化合物は市販されている。

20

【化14】



スキーム5

30

【0108】

既に示されるように、意外なことに、本発明に係る式(I)および(IA)の新規な化合物が、實際上、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る非常に有利なレベルの生物学的活性を有することがここで見出された。

40

【0109】

式(I)および(IA)の化合物は、農業部門および関連する使用分野において、例えば、植物有害生物または非生体材料の防除、ヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物の防除に係る活性処方成分として用いられることが可能である。新規化合物は、低施用量での優れた活性、植物による優れた耐容性、および、環境に対して安全であることにより際だって優れたものである。これらはきわめて有用な治療的特性、予防的特性および浸透移行特性を有すると共に、数多くの栽培植物の保護に用いられ得る。式(I)および(IA)の化合物は、有用な植物の異なる作物の植物または植物の一部（果実、花、葉、茎、塊茎、根）に生じる有害生物を阻害または駆除するために、他方では、同

50

時に、後に成長する植物のこれらの部位をも例えば植物病原性微生物から保護するために用いられることが可能である。

【0110】

本発明はさらに、植物または植物繁殖体および/または収穫された食品作物を処理することによって、微生物被害を受けやすい植物または植物繁殖体および/または収穫された食品作物の外寄生を防除または予防するための方法であって、有効量の式(I)または(IA)の化合物が、植物、その一部またはその生息地に適用される方法に関する。

【0111】

式(I)および(IA)の化合物を殺菌・殺カビ剤として用いることも可能である。「殺菌・殺カビ剤」という用語は、本明細書において用いられるところ、真菌の増殖を防除し、変性させ、または、防止する化合物を意味する。「殺菌・殺カビ的に有効な量」という用語は、用いられるところ、真菌の増殖に効果をもたらすことが可能である、このような化合物またはこのような化合物の組み合わせの量を意味する。防除または変性効果は、死滅、遅滞等などの自然の発育からの逸脱のすべてを含み、予防は、真菌による感染を予防するための植物におけるバリアまたは他の防御形成を含む。

10

【0112】

土壤中で発生する真菌性感染症、ならびに、植物病原性真菌に対する保護のために、例えば果実、塊茎もしくは穀粒などの種子または植物挿穂といった植物繁殖体を処理する粉衣剤として式(I)および(IA)の化合物を用いることも可能であり得る。この繁殖体は、植え付け前に式(I)または(IA)の化合物を含む組成物で処理することが可能である：例えば、種子は、播種される前に粉衣されることが可能である。式(I)および(IA)の活性化化合物はまた、種子を液体配合物中に含浸させるか、または、種子を固体配合物でコーティングすることにより穀粒に適用(コーティング)することが可能である。組成物はまた、繁殖体が植え付けられる際に植え付け箇所に適用が可能であり、例えば、播種の最中において蒔き溝に適用が可能である。本発明はまた、このような植物繁殖体の処理方法、および、このようにして処理された植物繁殖体にも関する。

20

【0113】

さらに、式(I)および(IA)化合物は、例えば、木材および木材系工業用製品を含む工業用材料の保護、食品保管、衛生管理といった関連する分野における真菌の防除に用いられることが可能である。

30

【0114】

加えて、本発明は、例えば材木、壁板および塗料といった非生体材料を真菌による作用から保護するために用いられることが可能である。

【0115】

式(I)および(IA)の化合物は、例えば、病害に係る真菌および真菌媒介物、ならびに、植物病原性バクテリアおよびウイルスに対して効果的である。これらの病害に係る真菌および真菌媒介物、ならびに、植物病原性バクテリアおよびウイルスは、例えば以下のとおりである。

【0116】

アブシジアコリムピフェラ(*Absidia corymbifera*)、アルテルナリア属の一種(*Alternaria spp.*)、アフアノミセス属の一種(*Aphanomyces spp.*)、アスコキタ属の一種(*Ascochyta spp.*)、A.フラバス(*A. flavus*)、A.フミガーツス(*A. fumigatus*)、A.ニズランス(*A. nidulans*)、A.ニガー(*A. niger*)、A.テルス(*A. terrus*)を含むアスペルギルス属の一種(*Aspergillus spp.*)、A.プルランス(*A. pullulans*)を含むアウレオバシジウム属の一種(*Aureobasidium spp.*)、ブラストミセスデルマチチディス(*Blastomyces dermatitidis*)、ブルメリアグラミニス(*Blumeria graminis*)、プレミアラクツカエ(*Bremia lactucae*)、B.ドチデア(*B. dothidea*)、B.オブツサ(*B. obtusa*)のボトリオスファエリ

40

50

ア属の一種 (*Botryosphaeria* spp.)、*B.シネレア* (*B. cinerea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、*C.アルビカンス* (*C. albicans*)、*C.グラブラータ* (*C. glabrata*)、*C.クルセイ* (*C. krusei*)、*C.ルシタニエ* (*C. lusitaniae*)、*C.パラプシロシス* (*C. parapsilosis*)、*C.トロピカリス* (*C. tropicalis*) のカンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、セファロアスクスフラグランズ (*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp.)、*C.アラキジコラ* (*C. arachidicola*) を含むセルコスポラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスפורリジウムペルソナツム (*Cercosporidium personatum*)、クラドスפורリウム属の一種 (*Cladosporium* spp.)、クラビセプスプルプレア (*Claviceps purpurea*)、コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp.)、*C.ムサエ* (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、クリプトコッカスネオフォルマンズ (*Cryptococcus neoformans*)、ジアポルテ属の一種 (*Diaporthe* spp.)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp.)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp.)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp.)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp.)、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、*E.シコラセアルム* (*E. cichoracearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、*F.クルモルム* (*F. culmorum*)、*F.グラミネアルム* (*F. graminearum*)、*F.ラングセチエ* (*F. langsethiae*)、*F.モニリホルメ* (*F. moniliforme*)、*F.オキシスポルム* (*F. oxysporum*)、*F.プロリフェラツム* (*F. proliferatum*)、*F.スブグルチナンス* (*F. subglutinans*)、*F.ソラニ* (*F. solani*) を含むフザリウム属の一種 (*Fusarium* spp.)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、ギベレラフジクROI (*Gibberella fujikuroi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムムサルム (*Gloeosporium musarum*)、グロメラリングレート (*Glomerella cingulate*)、ガイグナルディアビドウェリイ (*Guignardia bidwellii*)、ギムノスポランギウムジュニベリ-ヴィルギニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginiana*)、ヘルミントスポリウム属の一種 (*Helminthosporium* spp.)、ヘミレイア属の一種 (*Hemileia* spp.)、*H.カプストラツム* (*H. capsulatum*) を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma* spp.)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、レプトグラフィウムリンデベルギ (*Leptographium lindbergi*)、レveilラタウリカ (*Leveillula taurica*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、ミクロスポルム属の一種 (*Microsporium* spp.)、モニリニア属の一種 (*Monilinia* spp.)、ムコール属の一種 (*Mucor* spp.)、コムギ葉枯病菌 (*M. graminicola*)、*M.ポミ* (*M. pomi*) を含むミコスファエレラ属の一種 (*Mycosphaerella* spp.)、オンコバシジウムテオブロマエオン (*Oncobasidium theobromaen*)、オフィオストマピセエ (*Ophiostoma piceae*)、パラコジディオイデス属の一種 (*Paracoccidioides* spp.)、*P.ディジタツム* (*P. digitatum*)、*P.イタリクム* (*P. italicum*) を含むペニシリウム属の一種 (*Penicillium* spp.)、ペトリエリジウム属の一種 (*Petriellidium* spp.)、*P.メイデイス* (*P. m*

aydis)、P. フィリピンシス (P. philippinensis) および P. ソルギ (P. sorghi) を含むペロノスクレロスポラ属の一種 (Peronosclerospora spp.)、ペロノスポラ属の一種 (Peronospora spp.)、コムギふ枯病菌 (Phaeosphaeria nodorum)、ファコブソラパチリジ (Phakopsora pachyrhizi)、フェリヌスイグニアルス (Phellinus igniarius)、フィアロフォラ属の一種 (Phialophora spp.)、フォーマ属の一種 (Phoma spp.)、ホモブシスビティコーラ (Phomopsis viticola)、P. インフェスタンス (P. infestans) を含むフィトフトラ属の一種 (Phytophthora spp.)、P. ハルステジイ (P. halstedii)、P. ビチコーラ (P. viticola) を含む 10 プラスモパラ属の一種 (Plasmopara spp.)、プレオスポラ属の一種 (Pleospora spp.)、リンゴうどんこ病菌 (P. leucotricha) を含むポドスファエラ属の一種 (Podosphaera spp.)、ポリミキサグラミニス (Polymyxa graminis)、ポリミキサベタエ (Polymyxa betae)、シュードセルコスボレラヘルポトリコイド (Pseudocercospora herpotrichoides)、シュードモナス属の一種 (Pseudomonas spp.)、P. クベンシス (P. cubensis)、P. フムリ (P. humuli) を含むシュードペロノスポラ属の一種 (Pseudoperonospora spp.)、シュードベジザトラケイフィラ (Pseudopeziza tracheiphila)、P. ホルデイ (P. hordei)、P. レコンディタ (P. 20 recondita)、P. ストリイホルミス (P. striiformis)、P. トリチシナ (P. tritricina) を含むプッシニア属の一種 (Puccinia spp.)、ピレノベジザ属の一種 (Pyrenopeziza spp.)、ピレノフォラ属の一種 (Pyrenophora spp.)、イネいもち病菌 (P. oryzae) を含むピリクラリア属の一種 (Pyricularia spp.)、P. ウルチムム (P. ultimum) を含むピシウム属の一種 (Pythium spp.)、ラムラリア属の一種 (Ramularia spp.)、リゾクトニア属の一種 (Rhizoctonia spp.)、リゾムコールプシルス (Rhizomucor pusillus)、リゾプスアリズス (Rhizopus arrhizus)、リンコスפורウム属の一種 (Rhynchosporium spp.)、S. アピオスペルムム (S. apiospermum) および S. プロリフィカンス (S. proliferans) を含むセドスפורウム属の一種 (Scedosporium spp.)、スキゾチリウムポミ (Schizothyrium pomi)、スクレロチニア属の一種 (Sclerotinia spp.)、スクレロチウム属の一種 (Sclerotium spp.)、S. ノドルム (S. nodorum)、S. トリティシ (S. tritici) を含むセプトリア属の一種 (Septoria spp.)、スファエロテカマクラリス (Sphaerotheca macularis)、スファエロテカフスカ (Sphaerotheca fusca) (スファエロテカフリギネア (Sphaerotheca fuliginosa))、スポロトリクス属の一種 (Sporothrix spp.)、スタゴノスポラノドルム (Stagonospora nodorum)、ステムフィリウム属の一種 (Stemphylium spp.)、ステレウムヒルスツム (Stereum hirsutum)、タナテホルスクメリス (Thanatephorus cucumeris)、チエラビオブシスバシコーラ (Thielaviopsis basicola)、チレチア属の一種 (Tilletia spp.)、T. ハルジアヌム (T. harzianum)、T. シュードコニンギイ (T. pseudokoningii)、T. ヴィリデ (T. viride) を含むトリコデルマ属の一種 (Trichoderma spp.)、トリコフィトン属の一種 (Trichophyton spp.)、チフラ属の一種 (Typhula spp.)、ウンシヌラネカトル (Uncinula necator)、ウロシスチス (Urocystis spp.)、ウスチラゴ属の一種 (Ustilago spp.)、V. イナエクアリス (V. inaequalis) を含むベンチュリ 50

ア属の一種 (*Venturia* spp.)、ベルチシリウム属の一種 (*Verticillium* spp) およびキサントモナス属の一種 (*Xanthomonas* spp)。

【0117】

式 (I) および (IA) の化合物は、例えば芝生、観賞用作物、例えば花、低木、広葉樹または常緑樹、例えば針葉樹に、ならびに、樹木注入、有害生物管理などに使用される。

【0118】

本発明の範囲内においては、保護されるべき標的作物および/または有用な植物は、典型的には、例えばブラックベリー、ブルーベリー、クランベリー、ラズベリーおよびイチゴといった液果植物；例えばオオムギ、トウモロコシ（コーン）、キビ、カラスムギ、イネ、ライ麦、モロコシ属 (*sorghum*) ライコムギおよびコムギといった穀類；例えば綿、亜麻、アサ、ジュートおよびサイザルといった繊維植物；例えば糖質および飼料ビート、コーヒー、ホップ、マスタード、アブラナ（カノーラ）、ケシ、サトウキビ、ヒマワリ、チャおよびタバコといった農作物；例えばリンゴ、アンズ、アボカド、バナナ、サクランボ、柑橘類、ネクタリン、モモ、セイヨウナシおよびセイヨウスモモといった果樹；例えばパミュダグラス、イチゴツナギ、ベントグラス、センチピードグラス、ウシノケグサ、ライグラス、アメリカシバおよびノシバといった草；バジル、ルリジサ、チャイブ、コリアンダー、ラベンダー、ラベージ、ミント、オレガノ、パセリ、ローズマリー、セージおよびタイムなどのハーブ；例えばインゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメおよびダイズ、インゲンマメといったマメ科植物；例えばアーモンド、カシュー、落花生、ヘーゼルナッツ、ピーナッツ、ペカン、ピスタチオおよびクルミといった堅果；例えばアブラヤシといったヤシ；例えば花、低木および高木といった観賞用植物；例えばカカオ、ココナツ、オリーブおよびゴムといった他の高木；例えばアスパラガス、ナス、ブロッコリ、キャベツ、ニンジン、キュウリ、ニンニク、レタス、ペポカボチャ、メロン、オクラ、タマネギ、コショウ、ジャガイモ、カボチャ、ダイオウ、ハウレンソウおよびトマトといった野菜；ならびに、例えばブドウといったつる植物などの多年生および1年生作物を含む。

【0119】

「有用な植物」という用語は、従来 of 交配または遺伝子操作方法によって、プロモキシニルのような除草剤、または、ある分類の除草剤（例えば、HPPD抑制剤、ALS抑制剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロンおよびトリフロキシスルフロン、EPSPS（5-エノール-ピロビル-シキメート-3-リン酸塩-シターゼ）抑制剤、GS（グルタミンシンターゼ）抑制剤またはPPO（プロトポルフィリノーゲン-オキシダーゼ）抑制剤など）に対する耐性がもたらされた有用な植物をも含むと理解されるべきである。従来 of 交配方法（突然変異誘発）によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Clearfield（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子操作方法によって除草剤またはあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名Roundup Ready（登録商標）、Herculex I（登録商標）およびLiberty Link（登録商標）で市販されているグリホサート-およびグルホシネート-耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

【0120】

「有用な植物」という用語は、トキシン-産生バクテリア、特にバチルス属 (*Bacillus*) の由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を有する、組換えDNA技術を用いることで形質転換された有用な植物を含むとも理解されるべきである。

【0121】

このような植物の例は、YieldGard（登録商標）（CryIA(b)トキシンを発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Rootworm（登録商標）（

10

20

30

40

50

CryIIIB (b1)トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard Plus (登録商標) (CryIA (b)およびCryIIIB (b1)トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Starlink (登録商標) (Cry9 (c)トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Herculex I (登録商標) (CryIF (a2)トキシンおよび酵素ホスフィノトリシンN - アセチルトランスフェラーゼ (PAT)を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種) ; NuCOTN 33B (登録商標) (CryIA (c)トキシンを発現する綿品種) ; Bollgard I (登録商標) (CryIA (c)トキシンを発現する綿品種) ; Bollgard II (登録商標) (CryIA (c)およびCryIIA (b)トキシンを発現する綿品種) ; VIPCOT (登録商標) (VIPトキシンを発現する綿品種) ; NewLeaf (登録商標) (CryIIIAトキシンを発現するジャガイモ品種) ; NatureGard (登録商標) Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホサート - 耐性形質)、Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt11コーン穿孔性害虫 (CB) 形質)、Agrisure (登録商標) RW (コーンルートワーム形質) およびProtecta (登録商標) である。

10

## 【0122】

「作物」という用語は、例えば、トキシン - 産生バクテリア、特にバチルス属 (*Bacillus*) のバクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を有するよう、組換えDNA技術を用いることで形質転換された作物植物も含むと理解されるべきである。

20

## 【0123】

かかる形質転換植物によって発現されることが可能であるトキシンとしては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) またはバチルスポピリエ (*Bacillus popilliae*) 由来の殺虫性タンパク質; または、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エンドトキシンなどのバチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の殺虫性タンパク質、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (*Vip*); または、フォトラブダスルミネセンス (*Photobacterium luminescens*)、ゼノラブダスネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などの、例えばフォトラブダス属の一種 (*Photobacterium spp.*) もしくはゼノラブダス属の一種 (*Xenorhabdus spp.*) といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質; サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ (*wasp*) トキシンおよび他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン; ストレプトミセス (*Streptomyces*) トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチンまたはマツユキソウレクチンなどの植物レクチン; アグルチニン; トリプシン抑制剤、セリタンパク分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パバイン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤; リシン、トウモロコシ - RIP、アブリン、ルフィン、サポリンまたはプリオジンなどのリボソーム - 不活性化タンパク質 (RIP); 3 - ヒドロキシステロイドキシダーゼ、エクジステロイド - UDP - グリコシル - トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン抑制剤、HMG - COA - レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムまたはカルシウム遮断剤などのイオンチャネル遮断剤、幼虫ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシクターゼ、ピベンジルシクターゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。

30

40

## 【0124】

さらに、本発明の文脈においては、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エンドトキシン、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (*Vip*) とは、特にハイブリッドトキシン、切断型

50

トキシンおよび修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される（例えば、国際公開第02/15701号を参照のこと）。例えば切断型Cry1Abといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換において、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えば、Cry3A055の場合には、カテプシン-G-認識配列がCry3Aトキシンに挿入される（国際公開第03/018810号を参照のこと）。

#### 【0125】

このようなトキシン、または、このようなトキシンを合成可能な形質転換植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書および国際公開第03/052073号に開示されている。

10

#### 【0126】

このような形質転換植物の調製プロセスは一般に当業者に公知であり、例えば、上記の刊行物において記載されている。CryI-タイプデオキシリボ核酸およびその調製は、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書および国際公開第90/13651号から公知である。

20

#### 【0127】

形質転換植物に含有されるトキシンは、有害な昆虫に対する耐性を植物に付与する。このような昆虫は昆虫の分類群のいずれかのものであることが可能であるが、特に、甲虫（鞘翅目）、双翅昆虫（双翅目）および蝶（鱗翅目）に通例見出される。

#### 【0128】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含有する形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は：YieldGard（登録商標）（Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Rootworm（登録商標）（Cry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Plus（登録商標）（Cry1AbおよびCry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Starlink（登録商標）（Cry9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種）；Herculex I（登録商標）（Cry1Fa2トキシンおよび酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ（PAT）を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種）；NuCOTN 33B（登録商標）（Cry1Actトキシンを発現する綿品種）；Bollgard I（登録商標）（Cry1Actトキシンを発現する綿品種）；Bollgard II（登録商標）（Cry1AcおよびCry2Abトキシンを発現する綿品種）；VipCot（登録商標）（Vip3AおよびCry1Abトキシンを発現する綿品種）；NewLeaf（登録商標）（Cry3Aトキシンを発現するジャガイモ品種）；NatureGard（登録商標）、Agrisure（登録商標）GT Advantage（GA21グリホサート-耐性形質）、Agrisure（登録商標）CB Advantage（Bt11コーン穿孔性害虫（CB）形質）およびProtecta（登録商標）である。

30

40

#### 【0129】

このような形質転換作物のさらなる例は以下のとおりである：

1. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製 Bt11 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。切断型 Cry1Ab トキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ（ヨーロッパアワノメイガ（*Ostrinia nubilalis*）およびセサミアノナグリオイデス（*Sesamia nonagrioid*

50

es))に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ(Zea mays)。Bt11トウモロコシはまた、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

## 【0130】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France製Bt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Abトキシンのトランスジェニック発現によって、アワノメイガ(ヨーロッパアワノメイガ(Ostrinia nubilalis))およびセサミアノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides))に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ(Zea mays)。Bt176トウモロコシはまた、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

10

## 【0131】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France製MIR604トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。修飾Cry3Aトキシンのトランスジェニック発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシ。このトキシンは、カテプシン-Gタンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾されたCry3A055である。このような形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第03/018810号に記載されている。

20

## 【0132】

4. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製MON863トウモロコシ、登録番号C/DE/02/9。MON863は、Cry3Bb1トキシンを発現し、一定の鞘翅目昆虫に対する耐性を有する。

## 【0133】

5. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製IPC531綿、登録番号C/ES/96/02。

## 【0134】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium製1507トウモロコシ、登録番号C/NL/00/10。一定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するタンパク質Cry1Fの発現、および、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成するためのPATタンパク質の発現のために遺伝子操作されたトウモロコシ。

30

## 【0135】

7. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製NK603xMON810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子操作品種NK603およびMON810を交配させることによる従来交配型ハイブリッドトウモロコシ品種からなる。NK603xMON810トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種(Agrobacterium sp.)の菌株CP4から得られるタンパク質CP4EPSPSをトランスジェニック発現し、これにより、除草剤Roundup(登録商標)(グリホサートを含む)に対する耐性が付与され、また、バチルスチューリンゲンシス(Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki)から得られるCry1Abトキシンをトランスジェニック発現し、これにより、アワノメイガを含む一定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

40

## 【0136】

本明細書において用いられるところ、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、または、栽培されている植物の種子が播種された圃場、または、種子が土壤に蒔かれ

50

ることとなる圃場を意味する。これは、土壌、種子および実生、ならびに、確立した植生を含む。

【0137】

「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉および果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。

【0138】

「植物繁殖体」という用語は、その増殖に用いられることが可能である種子などの植物の生殖部、および、挿し木もしくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子（厳密な意味で）、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎および植物の部分が挙げられ得る。発芽後もしくは土壌から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物および若芽もまた挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全または部分的な処置によって保護されてもよい。好ましくは、「植物繁殖体」は種子を表すと理解される。

10

【0139】

式(I)および(IA)の化合物は、そのままの形態で、または、好ましくは、配合技術分野において簡便に採用される補助剤と一緒に用いられ得る。この目的のためにこれらは、公知の様式で、乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能もしくは希釈可能な溶液または懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物、および、例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティングまたは掛け流しなどの適用方法が、意図される目的およびその時点での状況に応じて選択される。組成物はまた、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダまたは粘着剤、ならびに、肥料、微量元素の供給源、または、特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤を含有していてもよい。

20

【0140】

例えば農業に用いられる好適なキャリアおよび補助剤は、固体または液体であることが可能であり、配合技術において有用な物質であり、例えば天然もしくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダまたは肥料である。このようなキャリアは、例えば国際公開第97/33890号に記載されている。

【0141】

懸濁液濃縮物は、活性な化合物の微細な固体粒子が懸濁した水性配合物である。このような配合物は沈降防止剤および分散剤を含むと共に、活性を高めるために湿潤剤、ならびに、消泡剤および結晶成長抑制剤をさらに含み得る。使用においては、これらの濃縮物は水中で希釈され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性処方成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

30

【0142】

水和剤は、水または他の液体キャリア中に容易に分散する微細粒子の形態である。これらの粒子は、固体マトリックスに保持された活性処方成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フーラー土、カオリンクレイ、シリカおよび他の易湿性の有機もしくは無機固形分が挙げられる。水和剤は通常、5%~95%の活性処方成分と少量の湿潤剤、分散剤または乳化剤とを含有する。

40

【0143】

乳化性濃縮物は水または他の液体中に分散性である均質な液体組成物であって、活性な化合物と液体もしくは固体乳化剤とからのみ構成されていてもよく、または、キシレン、高沸点芳香族ナフサ、イソホロンおよび他の不揮発性有機溶剤などの液体キャリアを含有していてもよい。使用においては、これらの濃縮物は水または他の液体中に分散され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性処方成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0144】

粒状配合物は押出物および比較的粗大な粒子の両方を含み、通常は、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、

50

活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、パーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、氷晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウムおよび他の有機もしくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は通常5%～25%の活性処方成分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシンおよび他の石油留分などの表面活性剤、もしくは、植物油；ならびに/または、デキストリン、膠もしくは合成樹脂などの展着剤を含んでいてもよい。

10

## 【0145】

粉剤は、活性処方成分と、分散剤およびキャリアとして作用するタルク、クレイ、粉末ならびに他の有機および無機固形分などの微細固形分との易流動性の混和物である。

## 【0146】

マイクロカプセルは、典型的には、内包された材料を制御された速度で周囲に放出させることが可能である不活性の多孔性シェルに内包された活性処方成分の小滴または顆粒である。カプセル化された小滴は、直径が典型的には1～50ミクロンである。内包された液体は典型的には、カプセルの重量の50～95%を構成し、活性な化合物に追加して溶剤を含んでいてもよい。カプセル化された顆粒は一般に、顆粒の孔部開口をシールして、液体形態の活性種を顆粒の孔部に保持する多孔性メンブランを有する多孔性顆粒である。顆粒は典型的には、直径が1ミリメートル～1センチメートル、好ましくは1～2ミリメートルの範囲内である。顆粒は、押し出し成形、凝塊もしくはブリルによって形成されるか、または、天然のものである。このような材料の例は、パーミキュライト、焼成クレイ、カオリン、アタパルジャイトクレイ、おがくずおよび粒状炭素である。シェルまたはメンブラン材料は、天然および合成ゴム、セルロース系材料、スチレン-ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタンおよびデンプンゼンデートを含む。

20

## 【0147】

農芸化学用途に係る他の有用な配合物は、アセトン、アルキル化ナフタレン、キシレンおよび他の有機溶剤などの、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における活性処方成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って活性処方成分が微細に分離された形態に散布される加圧散布機もまた用いられ得る。

30

## 【0148】

上記の配合物タイプの本発明の組成物の配合に有用である好適な農業用補助剤およびキャリアは、当業者に周知である。

## 【0149】

利用可能である液体キャリアとしては、例えば、水、トルエン、キシレン、石油ナフサ油、作物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、無水酢酸、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、アルキル酢酸塩、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアピエテート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサソラン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキトール、アルキルピロリジノン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、ピネン、d-リモネン、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、-ブチロラクトン、グリセロール、グリセロール二酢酸、グリセロール酢酸、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソ

40

50

ボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシ-プロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、クタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール(PEG400)、プロピオン酸、プロピレングリコール、プロピレングリコールモノメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、および、アミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール等などの高分子量アルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリンおよびN-メチル-2-ピロリジノンが挙げられる。濃縮物の希釈には、水が一般的に選択されるキャリアである。

10

## 【0150】

好適な固体キャリアとしては、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、チョーク、珪藻土、石灰、炭酸カルシウム、ベントナイトクレイ、フーラー土、綿実の外殻、小麦粉、ダイズ粉、軽石、木粉、クルミの外殻粉およびリグニンが挙げられる。

## 【0151】

幅広い範囲の表面活性剤が、特に適用前にキャリアで希釈されるよう設計されたものといった、前記液体および固体組成物の両方において有利に利用される。これらの表面活性剤は通常、使用される際、0.1%~15重量%の配合物を含む。これらはアニオン性、カチオン性、ノニオン性または高分子特性であることが可能であり、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または、他の目的のために利用されることが可能である。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネート塩；ノニルフェノール-C<sub>sub</sub>.18エトキシレートなどのアルキルフェノール-アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール-C<sub>sub</sub>.16エトキシレートなどのアルコール-アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホン酸塩；ジ(2-エチルヘキシル)スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレエートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびに、モノおよびジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

20

30

## 【0152】

農業用組成物において通例利用される他の補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度変性剤、懸濁剤、噴霧粒調節剤、顔料、酸化防止剤、発泡剤、消泡剤、遮光剤、相溶化剤、消泡剤、金属イオン封鎖剤、中和剤および緩衝剤、腐食抑制剤、染料、臭気剤、展着剤、浸透剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤および固着剤が挙げられる。

40

## 【0153】

さらに加えて、他の殺生性活性処方成分または組成物を、本発明の組成物と組み合わせ、本発明の方法において用い、および、本発明の組成物と同時にまたは順次に適用してもよい。同時に適用する場合、これらのさらなる活性処方成分は、本発明の組成物と一緒に配合されても、または、例えば、噴霧タンク中で一緒に混合されてもよい。これらのさらなる殺生性活性処方成分は、殺菌・殺カビ剤、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤および/または植物成長調節剤であり得る。

## 【0154】

慣用名を用いて本明細書において言及される有害生物防除剤は、例えば、“The Pesticide Manual”, 15th Ed., British Crop P

50

rotection Council 2009から公知である。

【0155】

加えて、本発明の組成物はまた、1種以上の全身獲得抵抗性誘導物質（「SAR」誘導物質）と一緒に適用され得る。SAR誘導物質は公知であって、例えば米国特許第6,919,298号明細書に記載されており、例えば、サリチル酸塩および市販されているSAR誘導物質であるアシベンゾラル-S-メチルが挙げられる。

【0156】

式(I)および(IA)の化合物は通常農芸化学組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域または植物に、さらなる化合物と同時に、または、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料もしくは微量元素供与物、または、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤もしくは非選択的な除草剤、ならびに、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤であることが可能であり、または、これらの調製物の数種の混合物であって、所望の場合には配合物の分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤もしくは適用促進補助剤を伴う混合物であることが可能である。

10

【0157】

式(I)および(IA)の化合物は、活性処方成分として少なくとも1種の式(I)または(IA)の化合物を含む、植物病原性微生物に対する防除もしくは保護のための(殺菌・殺カビ)組成物の形態で用いられ得、または、遊離形態もしくは農芸化学的に使用可能な塩形態の本明細書に定義されている少なくとも1種の好ましい個別の化合物と、上記の補助剤の少なくとも1種との形態で用いられ得る。

20

【0158】

本発明は従って、少なくとも1種の式(I)または(IA)の化合物、農学的に許容可能なキャリア、および、任意選択により補助剤を含む、組成物、好ましくは殺菌・殺カビ組成物を提供する。農学的に許容可能なキャリアは、例えば農業用途に好適なキャリアである。農業用キャリアは技術分野において周知である。好ましくは、前記組成物は、式(I)または(IA)の化合物に追加して、少なくとも1種以上の有害生物防除的に活性な化合物、例えば追加の殺菌・殺カビ性活性処方成分を含んでいてもよい。

【0159】

式(I)または(IA)の化合物は、組成物における唯一の活性処方成分であってもよく、また、適切な場合、有害生物防除剤、殺菌・殺カビ剤、共力剤、除草剤または植物成長調節剤などの1種以上の追加の活性処方成分と混合されてもよい。追加の活性処方成分は、いくつかの場合において、予期しない相乗的活性をもたらし得る。

30

【0160】

好適な追加の活性処方成分の例としては、以下のアシルアミノ酸殺菌・殺カビ剤、脂肪酸窒素殺菌・殺カビ剤、アミド殺菌・殺カビ剤、アニリド殺菌・殺カビ剤、抗生物質殺菌・殺カビ剤、芳香族殺菌・殺カビ剤、ヒ素殺菌・殺カビ剤、アリールフエニルケトン殺菌・殺カビ剤、ベンズアミド殺菌・殺カビ剤、ベンズアニリド殺菌・殺カビ剤、ベンズイミダゾール殺菌・殺カビ剤、ベンゾチアゾール殺菌・殺カビ剤、植物学的殺菌・殺カビ剤、架橋ジフェニル殺菌・殺カビ剤、カルバメート殺菌・殺カビ剤、カルバニレート殺菌・殺カビ剤、コナゾール殺菌・殺カビ剤、銅殺菌・殺カビ剤、ジカルボキシイミド殺菌・殺カビ剤、ジニトロフェノール殺菌・殺カビ剤、ジチオカルバメート殺菌・殺カビ剤、ジチオラン殺菌・殺カビ剤、フラミド殺菌・殺カビ剤、フラニリド殺菌・殺カビ剤、ヒドラジド殺菌・殺カビ剤、イミダゾール殺菌・殺カビ剤、水銀殺菌・殺カビ剤、モルホリン殺菌・殺カビ剤、有機リン殺菌・殺カビ剤、有機スズ殺菌・殺カビ剤、オキサチン殺菌・殺カビ剤、オキサゾール殺菌・殺カビ剤、フェニルスルファミド殺菌・殺カビ剤、ポリスルフィド殺菌・殺カビ剤、ピラゾール殺菌・殺カビ剤、ピリジン殺菌・殺カビ剤、ピリミジン殺菌・殺カビ剤、ピロール殺菌・殺カビ剤、第4級アンモニウム殺菌・殺カビ剤、キノリン殺菌・殺カビ剤、キノン殺菌・殺カビ剤、キノキサリン殺菌・殺カビ剤、ストロビルリン殺菌・殺カビ剤、スルホンアニリド殺菌・殺カビ剤、チアジアゾール殺菌・殺カビ剤、

40

50

チアゾール殺菌・殺カビ剤、チアゾリジン殺菌・殺カビ剤、チオカルバメート殺菌・殺カビ剤、チオフエン殺菌・殺カビ剤、トリアジン殺菌・殺カビ剤、トリアゾール殺菌・殺カビ剤、トリアゾロピリミジン殺菌・殺カビ剤、尿素殺菌・殺カビ剤、バリンアミド殺菌・殺カビ剤および亜鉛殺菌・殺カビ剤が挙げられる。

【 0 1 6 1 】

好適な追加の活性処方成分の例としてはまた、以下が挙げられる：3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ( 9 - ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン - 5 - イル ) - アミド、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸メトキシ - [ 1 - メチル - 2 - ( 2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル ) - エチル ] - アミド、1 - メチル - 3 - ジフル  
10  
オロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ( 2 - ジクロロメチレン - 3 - エチル - 1 - メチル - インダン - 4 - イル ) - アミド ( 1 0 7 2 9 5 7 - 7 1 - 1 )、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ( 4 ' - メチルスルファニル - ビフェニル - 2 - イル ) - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 4 H - ピラ  
20  
ゾール - 4 - カルボン酸 [ 2 - ( 2 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 2 - メトキシ - 1 - メチル - エチル ] - アミド、( 5 - クロロ - 2 , 4 - ジメチル - ピリジン - 3 - イル ) - ( 2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル - フェニル ) - メタノン、( 5 - ブロモ - 4 - ク  
30  
ロロ - 2 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル ) - ( 2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル - フェニル ) - メタノン、2 - { 2 - [ ( E ) - 3 - ( 2 , 6 - ジクロロ - フェニル ) - 1 - メチル - プロブ - 2 - エン - ( E ) - イリデンアミノオキシメチル ] - フェニル } -  
40  
2 - [ ( Z ) - メトキシイミノ ] - N - メチル - アセトアミド、3 - [ 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 2 , 3 - ジメチル - イソキサゾリン - 3 - イル ] - ピリジン、( E ) - N - メチル - 2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジメチルフェノキシメチル ) フェニル ] - 2 - メトキシ  
50  
- イミノアセタミド、4 - ブロモ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 6 - トリフルオロメチルベンズイミダゾール - 1 - スルホンアミド、a - [ N - ( 3 - クロロ - 2 , 6 - キシリル ) - 2 - メトキシアセタミド ] - y - ブチロラクトン、4 - クロロ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 5 - p - トリルイミダゾール - 1 - スルホンアミド、N - アリル - 4 , 5 , - ジメチル - 2 - トリメチルシリルチオフエン - 3 - カルボキサミド、N - ( 1 - シ  
60  
アノ - 1 , 2 - ジメチルプロピル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジクロロフェノキシ ) プロピオンア  
70  
ミド、N - ( 2 - メトキシ - 5 - ピリジル ) - シクロプロパンカルボキサミド、( . + . ) - c i s - 1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) - シクロヘプタノール、2 - ( 1 - t - ブチル ) - 1 - ( 2 - クロロフェニル ) - 3 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) - プロパン - 2 - オール、2 ' , 6 ' - ジ  
80  
ブromo - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4 ' - トリフルオロメチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド、1 - イミダゾリル - 1 - ( 4 ' - クロロフェ  
90  
ノキシ ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - オン、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - [ 6 - ( 2 - シアノフェノキシ ) ピリミジン - 4 - イルオキシ ] フェニル ] 3 - メトキシアクリレート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - [ 6 - ( 2 - フ  
100  
ルオロフェノキシ ) ピリミジン - 4 - イルオキシ ] フェニル ] - 3 - メトキシアクリ  
110  
レート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - [ 6 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェノキシ ) ピリミジン - 4 - イルオキシ ] フェニル ] - 3 - メトキシアクリレート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - [ 3 - ( ピリミジン - 2 - イルオキシ ) フェノキシ ] フェニル ] - 3 - メトキシアクリ  
120  
レート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - [ 3 - ( 5 - メチルピリミジン - 2 - イルオキシ ) - フェノキシ ] フェニル ] - 3 - メトキシアクリレート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - [ 3 - ( フェニル - スルホニルオキシ ) フェノキシ ] フェニル ] - 3 - メトキシアクリ  
130  
レート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - [ 3 - ( 4 - ニトロフェノキシ ) フェノキシ ] フェニル ] - 3 - メ  
140  
トキシアクリレート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - フェノキシフェニル ] - 3 - メトキシア  
150  
クリレート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - ( 3 , 5 - ジメチル - ベンゾイル ) ピロール - 1 - イル ] - 3 - メトキシアクリレート、メチル ( E ) - 2 - [ 2 - ( 3 - メトキシフェノ

キシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 [ 2 - ( 2 - フェニルエテン - 1 - イル) - フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - ( 3 , 5 - ジクロロフェノキシ)ピリジン - 3 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - ( 2 - ( 3 - ( 1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ)フェノキシ)フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - ( 2 - [ 3 - ( - ヒドロキシベンジル)フェノキシ]フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - ( 2 - ( 4 - フェノキシピリジン - 2 - イルオキシ)フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - ( 3 - n - プロピルオキシ - フェノキシ)フェニル] 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - ( 3 - イソプロピルオキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フルオロフェノキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - ( 3 - エトキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - ( 4 - t - ブチル - ピリジン - 2 - イルオキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - [ 3 - ( 3 - シアノフェノキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - [ ( 3 - メチル - ピリジン - 2 - イルオキシメチル)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - [ 6 - ( 2 - メチル - フェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - ピリジン - 2 - イルオキシメチル)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - ( 3 - ( 3 - ヨードピリジン - 2 - イルオキシ)フェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - [ 2 - [ 6 - ( 2 - クロロピリジン - 3 - イルオキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) , (E) - 2 - [ 2 - ( 5 , 6 - ジメチルピラジン - 2 - イルメチルオキシミノメチル)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - { 2 - [ 6 - ( 6 - メチルピリジン - 2 - イルオキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシ - アクリレート、メチル(E) , (E) - 2 - { 2 - ( 3 - メトキシフェニル)メチルオキシミノメチル] - フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - { 2 - ( 6 - ( 2 - アジドフェノキシ) - ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) , (E) - 2 - { 2 - [ 6 - フェニルピリミジン - 4 - イル) - メチルオキシミノメチル]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) , (E) - 2 - { 2 - [ ( 4 - クロロフェニル) - メチルオキシミノメチル] - フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) - 2 - { 2 - [ 6 - ( 2 - n - プロピルフェノキシ) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル(E) , (E) - 2 - { 2 - [ ( 3 - ニトロフェニル)メチルオキシミノメチル]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、3 - クロロ - 7 - ( 2 - アザ - 2 , 7 , 7 - トリメチル - オクタ - 3 - エン - 5 - イン)、2 , 6 - ジクロロ - N - ( 4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、3 - ヨード - 2 - プロピニルアルコール、4 - クロロフェニル - 3 - ヨードプロバルギルホルマル、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロペニルエチルカルバメート、2 , 3 , 3 - トリヨードアリルアルコール、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロペニルアルコール、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ブチルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ヘキシルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルシクロヘキシル - カルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルフェニルカルバメート; トリプロモフェノール、テトラクロロフェノール、3 - メチル - 4 - クロロフェノール、3 , 5 - ジメチル - 4 - クロロフェノール、フェノキシエタノール、ジクロロフェン、o - フェニルフェノール、m - フェニルフェノール、p - フェニルフェノール、2 - ベンジル - 4 - クロロフェノール、5 - ヒドロキシ - 2 ( 5 H ) - フラノンなどのフェノール; 4 , 5 - ジクロロジチアゾリノン、4 , 5 - ベンゾジチアゾリノン、4 , 5 - トリメチレンジチアゾリノン、4 , 5 - ジクロロ - ( 3 H ) - 1 , 2 - ジチオール - 3 - オン、3 , 5 - ジメチル - テトラヒドロ - 1 , 3 , 5 - チアジジン - 2 - チオン、N - ( 2 - p - クロロベンゾイルエチル) - ヘキサミニウムクロリ

10

20

30

40

50

ド、アシベンゾラル、アシペタックス、アラニカルブ、アルベンダゾール、アルジモルフ、アリシン、アリルアルコール、アメトクトラジン、アミスルブロム、アモバム、アンプロピルホス、アニラジン、アソメート、オーレオフンギン、アザコナゾール、アザフェンジン、アジチラム、アゾキシストロピン、バリウムポリスルフィド、ベナラキシル、ベナラキシル - M、ベノダニル、ベノミル、ベンキノックス、ベントアルロン、ベンチアバリカルブ、ベンチアゾール、塩化ベンザルコニウム、ベンザマクリル、ベンザモルフ、ベンゾヒドロキサム酸、ベンゾビンジフルビル、ベルベリン、ベトキサジン、ピロキサゾール、ピナパクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピチオノール、ピキサフェン、プラストサイジン - S、ポスカリド、プロモタロニル、プロムコナゾール、プピリメート、プチオベート、プチルアミン多硫酸カルシウム、カプタホール、キャプタン、カルバモルフ、カルベンダジム、カルベンダジムクロリドレート、カルボキシ、カルプロパミド、カルボン、CGA 4 1 3 9 6、CGA 4 1 3 9 7、キノメチオネート、キトサン、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロラニル、クロルフェナゾール、クロロネブ、クロルピクリン、クロロタロニル、クロロゾリネート、クロゾリネート、クリンバゾール、クロトリマゾール、クロジラコン、酢酸銅、炭酸銅、水酸化銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、オキシ塩化銅、オキシキノリン酸銅、ケイ酸銅、硫酸銅、タル油酸銅、クロム酸銅亜鉛およびボルドー液などの銅含有化合物、クレゾール、クフラエブ、クプロバム、酸化第一銅、シアゾファミド、シクラファミド、シクロヘキシミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シベンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ、デカフェンチン、デヒドロ酢酸、ジ - 2 - ピリジルジスルフィド 1, 1' - ジオキシド、ジクロフルアニド、ジクロメジン、ジクロン、ジクロラン、ジクロロフェン、ジクロゾリン、ジクロブトラゾール、ジクロシメット、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾコート、ジフルメトリム、O - ジ - イソ - プロピル - S - ベンジルチオホスフェート、ジメフルアゾール、ジメタクロン、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、ジメチリモール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ジノプトン、ジノカップ、ジノクトン、ジノペントン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジスルフィラム、ジタリムホス、ジチアノン、ジチオエーテル、ドデシルジメチル塩化アンモニウム、ドデモルフ、ドジチン、ドジン、ドグアジン、ドラゾキシロン、エディフェンホス、エネストロブリン、エポキシコナゾール、エタコナゾール、エテム、エタボキサム、エチリモール、エトキシキン、エチリシン、エチル (Z) - N - ベンジル - N ( [メチル (メチル - チオエチリデンアミノ - オキシカルボニル) アミノ] チオ) - - アラニナト、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェンアミドン、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンピコキサミド、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、トリフェニルスズヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキシニル、フルメトベル (flumetover)、フルモルフ、フルピコリド、フルオピラム、フルオロイミド、フルトリマゾール、フルオキサストロピン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルタニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルペット、ホルムアルデヒド、ホセチル、フベリダゾール、フララキシル、フラメトビル、フルカルバニル、フルコナゾール、ルフラール、フルメシクロックス、フロファネート、グリオジン、グリセオフラビン、グアザチン、ハラクリネート、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサクロロブタジエン、ヘキサクロロフェン、ヘキサコナゾール、ヘキシルチオホス、ヒドラルガフェン、ヒドロキシイソキサゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、三酢酸イミノクタジン、イネジン、ヨードカルブ、イブコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、イソパレジオン、イゾパムホス、カスガマイシン、クレソキシム - メチル、LY 1 8 6 0 5 4、LY 2 1 1 7 9 5、LY 2 4 8 9 0 8、マンコゼブ、マンジプロパミド、マンネブ、メベニル、メカルビンジド、メフェノキサム、メフェントリフルコナ

ゾール、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、塩化第一水銀、メブチルジノカップ、メタラキシル、メタラキシル - M、メタム、メタゾキシロン、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メタフロキサム、臭化メチル、ヨウ化メチル、メチルイソチオシアネート、メチラム、メチラム - 亜鉛、メトミノストロピン、メトラフェノン、メツルホバクス、ミルネブ、モロキシジン、マイクロブタニル、マイクロゾリン、ナーバム、ナタミシン、ネオアソジン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロスチレン、ニトロタル - イソ - プロピル、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、有機水銀化合物、オリザストロピン、オストール、オキサジキシル、オキサスルフロン、オキサチアピプロリン、オキシ銅、オキシリン酸、オキスポコナゾール、オキシカルボキシ、パリノール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ペンチオピラド、フェナマクリル、フェナジンオキシド、ホスジフェン、ホセチル - A 1、リン酸、フタリド、ピコキシストロピン、ピペラリン、ポリカルバメート、ポリオキシシロリン、ポリオキシリム、ポリラム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパミジン、プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピジフルメトフェン、ピラカルボリド、ピラクロストロピン、ピラメトロストロピン、ピラオキシストロピン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリジニトリル、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリオフェノン、ピロキロン、ピロキシクロール、ピロキシフル、ピロールニトリン、第 4 級アンモニウム化合物、キナセトール、キナザミド、キンコナゾール、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、ラベンザゾール、サントニン、セダキサ、シルチオフアム、シメコナゾール、シブコナゾール、5 塩化石炭酸ナトリウム、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、スルトロペン、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チアジフロル、チシオフエン、チフルザミド、2 - (チオシアノメチルチオ)ベンゾチアゾール、チオフアネート - メチル、チオキノックス、チラム、チアジニル、チミベンコナゾール、チオキサミド、トルコホス - メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアミホス、トリアリモル、トリアズブチル、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロピン、トリフルマゾール、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ウルバシド、バリダマイシン、バリフェナレート、ババム、ピンクロゾリン、ザリルアミド、ジネブ、ジラム、およびゾキサミド。

10

20

30

## 【 0 1 6 2 】

本発明の化合物はまた、駆虫薬薬剤との組み合わせで用いられ得る。このような駆虫薬としては、欧州特許第 3 5 7 4 6 0 号明細書、欧州特許第 4 4 4 9 6 4 号明細書および欧州特許第 5 9 4 2 9 1 号明細書に記載されているとおり、イベルメクチン、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エピリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチン、モキシデクチン、ネマデクチンおよびミルベマイシン誘導体などの化合物の大環式ラクトンクラスから選択される化合物が挙げられる。追加の駆虫薬としては、米国特許第 5 0 1 5 6 3 0 号明細書、国際公開第 9 4 1 5 9 4 4 号および国際公開第 9 5 2 2 5 5 2 号に記載されているものなどの半合成および生合成アベルメクチン/ミルベマイシン誘導体が挙げられる。追加の駆虫薬としては、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オキシフェンダゾール、オキシベンダゾール、パルベンダゾール、および、このクラスの他の構成要素などのベンズイミダゾールが挙げられる。追加の駆虫薬としては、イミダゾチアゾール、および、テトラミソール、レバミゾール、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、オキサニルまたはモランテルなどのテトラヒドロピリミジンが挙げられる。追加の駆虫薬としては、トリクラベンダゾールおよびクロルスロンなどのフルキシド、ならびに、ブラジカンテルおよびエブシプランテルなどのセストサイド (cestocide) が挙げられる。

40

## 【 0 1 6 3 】

本発明の化合物は、パラヘルクアミド/マルクホルチンクラスの駆虫薬の誘導体および類似体、ならびに、米国特許第 5 4 7 8 8 5 5 号明細書、米国特許第 4 6 3 9 7 7 1 号明

50

細書および独国特許第 1 9 5 2 0 9 3 6 号明細書に開示されているものなどの抗寄生虫性オキサゾリンとの組み合わせで用いられ得る。

【 0 1 6 4 】

本発明の化合物は、国際公開第 9 6 / 1 5 1 2 1 号に記載されている一般的なクラスのジオキソモルホリン抗寄生虫性薬剤の誘導体および類似体との組み合わせで、また、国際公開第 9 6 / 1 1 9 4 5 号、国際公開第 9 3 / 1 9 0 5 3 号、国際公開第 9 3 / 2 5 5 4 3 号、欧州特許第 0 6 2 6 3 7 5 号明細書、欧州特許第 0 3 8 2 1 7 3 号明細書、国際公開第 9 4 / 1 9 3 3 4 号、欧州特許第 0 3 8 2 1 7 3 号明細書、および、欧州特許第 0 5 0 3 5 3 8 号明細書に記載のものなどの駆虫活性環式デブシペプチドとの組み合わせで用いられ得る。

10

【 0 1 6 5 】

本発明の化合物は、他の外寄生生物撲滅薬；例えば、フィプロニル；ピレスロイド；有機リン酸エステル；ルフェヌロンなどの昆虫成長調節剤；テブフェノジド等などのエクジソンアゴニスト；イミダクロプリド等などのネオニコチノイドとの組み合わせで用いられ得る。

【 0 1 6 6 】

本発明の化合物は、例えば国際公開第 9 5 / 1 9 3 6 3 号または国際公開第 0 4 / 7 2 0 8 6 号に記載のものといったテルペンアルカロイドであって、特にこれらに開示の化合物との組み合わせで用いられ得る。

【 0 1 6 7 】

本発明の化合物が組み合わせられて用いられ得るこのような生物学的に有効な化合物の他の例としては、これらに限定されることはないが、以下が挙げられる。

20

【 0 1 6 8 】

有機リン酸エステル：アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、プロモホス、プロモホス - エチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルピリホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、デメトン、デメトン - S - メチル、デメトン - S - メチルスルホン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、ファンファー、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、フォノホス、ホルモチオン、ホスチアゼート、ヘブテノホス、イサゾホス、イソチオエート、イソキサチオン、マラチオン、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチル - パラチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン - メチル、パラオキソン、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロパホス、プロエタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダペンチオン、キナルホス、スルプロホス、テムホス、テルブホス、テブピリムホス、テトラクロルピンホス、チメトン ( t h i m e t o n )、トリアゾホス、トリクロルホン、パミドチオン。

30

【 0 1 6 9 】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2 - s e c - ブチルフェニルメチルカルバメート、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、クロエトカルブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ、フェンチオカルブ、フラチオカルブ、H C N - 8 0 1、イソプロカルブ、インドキサカルブ、メチオカルブ、メソミル、5 - メチル - m - クメニルブチリル ( メチル ) カルバメート、オキサミル、ピリミカーブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、U C - 5 1 7 1 7。

40

【 0 1 7 0 】

ピレスロイド：アクリナチン ( a c r i n a t h i n )、アレトリン、アルファメトリン ( a l p h a m e t r i n )、5 - ベンジル - 3 - フリルメチル ( E ) - ( 1 R ) - シス - 2 , 2 - ジメチル - 3 - ( 2 - オキソチオラン - 3 - イリデンメチル ) シクロプロパンカルボキシレート、ピフェントリン、 - シフルトリン、シフルトリン、 - シベルメ

50

トリン、*trans*-シペルメトリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン((*S*)-シクロペンチル異性体)、ピオレスメトリン、ピフェントリン、NCI-85193、シクロプロトリン、シハロトリン、シチトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エムペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンフルトリン、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート(*D*異性体)、イミプロトリン、シハロトリン、*trans*-シハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、ピレトリン(天然生成物)、レスメスリン、テトラメトリン、トランスフルトリン、*trans*-シペルメトリン、シラフルオフエン、*trans*-フルバリネート、テフルトリン、トラロメトリン、*trans*-シペルメトリン。

【0171】

節足動物成長調節剤：a)キチン合成抑制剤：ベンゾイル尿素：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルアズロン、フルシクロクソン、フルフェノクソン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、プロロフェジン、ジオフェノラン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロルフェンタジン；b)エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；c)ジュベノイド：ピリプロキシフェン、メトプレン(*S*-メトプレンを含む)、フェノキシカルブ；d)脂質生合成抑制剤：スピロジクロフェン。

【0172】

他の抗寄生虫薬：アセキノシル、アミトラズ、AKD-1022、ANS-118、アザジラクチン、バチルスチューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)、ベンサルタップ、ピフェナゼート、ピナバクリル、プロモプロピレート、BTG-504、BTG-505、カンフェクロール、カルタップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナピル、クロマフェノジド、クロチアニジン(*clothianidine*)、シロマジン、ジアクロデン、ジアフェンチウロン、DBI-3204、ジナクチン、ジヒドロキシメチルジヒドロキシピロリジン、ジノプトン、ジノカップ、エンドスルファン、エチプロール、エトフェンプロクス、フェナザキン、フルマイト、MTI-800、フェンピロキシメート、フルアクリピリム、フルベンジミン、フルプロシトリネート、フルフェンジン、フルフェンプロックス、フルプロキシフェン、ハロフェンプロックス(*halofenprox*)、ヒドラメチルノン、IKI-220、カネマイト、NC-196、ニームガード、ニジノルテルフラン、ニテンピラム、SD-35651、WL-108477、ピリダリル、プロバルギット、プロトリフェンプト、ピメトロジン(*pymethrozine*)、ピリダベン、ピリミジフェン、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、シラフルオフエン、シロマジン、スピノサド、テブフェンピラド、テトラジホン、テトラナクチン(*tetranactin*)、チアクロプリド、チオシクラム、チアメトキサム、トルフェンピラド、トリアザメート、トリエトキシスピノシン、トリナクチン、ベルブチン、ベルタレク、YI-5301。

【0173】

生物剤：バチルスチューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*, *kurstaki*)、バチルスチューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*) エンドトキシン、バキュロウイルス、昆虫病原性バクテリア、ウイルスおよび真菌。

【0174】

殺菌剤：クロルテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、ストレプトマイシン。

【0175】

他の生物剤：エンロフロキサシン、フェバンテル、ペネタメート、モロキシカム、セファレキシン、カナマイシン、ピモベンダン、クレンブテロール、オメプラゾール、チアムリン、ベナゼプリル、ピリプロール、セフキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、セフォベシン、ツラスロマイシン、セフチオウル、カルプロフェン、メタフルミゾン、プラジクアランテル、トリクラベンダゾール。

10

20

30

40

50

## 【 0 1 7 6 】

式 ( I ) または ( I A ) の化合物と活性処方成分との以下の混合物が好ましい。略記「 T X 」は：表 1 . 1 A ~ 1 . 4 A、表 1 . 1 B ~ 1 . 4 B または表 T 1 若しくは T 2 ( 以下 ) に記載されている化合物からなる群から選択される 1 種の化合物を意味する。

石油 ( 代替名 ) ( 6 2 8 ) + T X からなる物質群から選択される補助剤、

1 , 1 - ビス ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - エトキシエタノール ( I U P A C 名 ) ( 9 1 0 ) + T X、2 , 4 - ジクロロフェニルベンゼンスルホネート ( I U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名 ) ( 1 0 5 9 ) + T X、2 - フルオロ - N - メチル - N - 1 - シンナムアルデヒド ( I U P A C 名 ) ( 1 2 9 5 ) + T X、4 - クロロフェニルフェニルスルホン ( I U P A C 名 ) ( 9 8 1 ) + T X、アバメクチン ( 1 ) + T X、アセキノシル ( 3 ) + T X、アセトプロール [ C C N ] + T X、アクリナトリン ( 9 ) + T X、アルジカルブ ( 1 6 ) + T X、アルドキシカルブ ( 8 6 3 ) + T X、 - シベルメトリン ( 2 0 2 ) + T X、アミジチオン ( 8 7 0 ) + T X、アミドフルメト [ C C N ] + T X、アミドチオエート ( 8 7 2 ) + T X、アミトン ( 8 7 5 ) + T X、シュウ酸水素アミトン ( 8 7 5 ) + T X、アミトラズ ( 2 4 ) + T X、アラマイト ( 8 8 1 ) + T X、三酸化ヒ素 ( 8 8 2 ) + T X、A V I 3 8 2 ( 化合物コード ) + T X、A Z 6 0 5 4 1 ( 化合物コード ) + T X、アジンホス - エチル ( 4 4 ) + T X、アジンホス - メチル ( 4 5 ) + T X、アゾベンゼン ( I U P A C 名 ) ( 8 8 8 ) + T X、アゾシクロチン ( 4 6 ) + T X、アゾトエート ( 8 8 9 ) + T X、ベノミル ( 6 2 ) + T X、ベノキサホス ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、ベンゾキメート ( 7 1 ) + T X、ベンジル安息香酸塩 ( I U P A C 名 ) [ C C N ] + T X、ピフェナゼート ( 7 4 ) + T X、ピフェントリン ( 7 6 ) + T X、ピナバクリル ( 9 0 7 ) + T X、プロフェンパレレート ( 代替名 ) + T X、プロモシクレン ( 9 1 8 ) + T X、プロモホス ( 9 2 0 ) + T X、プロモホス - エチル ( 9 2 1 ) + T X、プロモプロピレート ( 9 4 ) + T X、プロロフェジン ( 9 9 ) + T X、プトカルボキシム ( 1 0 3 ) + T X、プトキシカルボキシム ( 1 0 4 ) + T X、プチルピリダベン ( 代替名 ) + T X、多硫酸カルシウム ( I U P A C 名 ) ( 1 1 1 ) + T X、カンフェクロール ( 9 4 1 ) + T X、カルパノレート ( 9 4 3 ) + T X、カルバリル ( 1 1 5 ) + T X、カルボフラン ( 1 1 8 ) + T X、カルボフェノチオン ( 9 4 7 ) + T X、C G A 5 0 ' 4 3 9 ( 開発コード ) ( 1 2 5 ) + T X、キノメチオネート ( 1 2 6 ) + T X、クロルベンシド ( 9 5 9 ) + T X、クロルジメホルム ( 9 6 4 ) + T X、クロルジメホルムヒドロクロリド ( 9 6 4 ) + T X、クロルフェナピル ( 1 3 0 ) + T X、クロルフェネトール ( 9 6 8 ) + T X、クロルフェンソン ( 9 7 0 ) + T X、クロルフェンスルフィド ( 9 7 1 ) + T X、クロルフェンビンホス ( 1 3 1 ) + T X、クロロベンジラート ( 9 7 5 ) + T X、クロロメブホルム ( 9 7 7 ) + T X、クロロメチウロン ( 9 7 8 ) + T X、クロロプロピレート ( 9 8 3 ) + T X、クロルピリホス ( 1 4 5 ) + T X、クロルピリホス - メチル ( 1 4 6 ) + T X、クロルチオホス ( 9 9 4 ) + T X、シネリン I ( 6 9 6 ) + T X、シネリン I I ( 6 9 6 ) + T X、シネリンス ( 6 9 6 ) + T X、クロフェンテジン ( 1 5 8 ) + T X、クロサンテル ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、クマホス ( 1 7 4 ) + T X、クロタミトン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、クロトキシホス ( 1 0 1 0 ) + T X、クフラエブ ( 1 0 1 3 ) + T X、シアントエート ( 1 0 2 0 ) + T X、シフルメトフェン ( C A S 登録番号 : 4 0 0 8 8 2 - 0 7 - 7 ) + T X、シハロトリン ( 1 9 6 ) + T X、シヘキサチン ( 1 9 9 ) + T X、シベルメトリン ( 2 0 1 ) + T X、D C P M ( 1 0 3 2 ) + T X、D D T ( 2 1 9 ) + T X、デメフィオン ( 1 0 3 7 ) + T X、デメフィオン - O ( 1 0 3 7 ) + T X、デメフィオン - S ( 1 0 3 7 ) + T X、デメトン ( 1 0 3 8 ) + T X、デメトン - メチル ( 2 2 4 ) + T X、デメトン - O ( 1 0 3 8 ) + T X、デメトン - O - メチル ( 2 2 4 ) + T X、デメトン - S ( 1 0 3 8 ) + T X、デメトン - S - メチル ( 2 2 4 ) + T X、デメトン - S - メチルスルホン ( 1 0 3 9 ) + T X、ジアフェンチウロン ( 2 2 6 ) + T X、ジアリホス ( 1 0 4 2 ) + T X、ダイアジノン ( 2 2 7 ) + T X、ジクロフルアニド ( 2 3 0 ) + T X、ジクロルボス ( 2 3 6 ) + T X、ジクリホス ( 代替名 ) + T X、ジコホル ( 2 4 2 ) + T X、ジクロトホス ( 2 4 3 ) + T X、ジエノクロル ( 1 0 7 1 ) +

TX、ジメホクス(1081)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジナクチン(代替名)(653)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクスジクレキシン(1089)+TX、ジノブトン(269)+TX、ジノカップ(270)+TX、ジノカップ-4[CCN]+TX、ジノカップ-6[CCN]+TX、ジノクトン(1090)+TX、ジノペントン(1092)+TX、ジノスルホン(1097)+TX、ジノテルボン(1098)+TX、ジオキサチオン(1102)+TX、ジフェニルスルホン(IUPAC名)(1103)+TX、ジスルフィラム(代替名)[CCN]+TX、ジスルホトン(278)+TX、DNOC(282)+TX、ドフェナピン(1113)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エンドスルファン(294)+TX、エンドチオン(1121)+TX、EPN(297)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エチオン(309)+TX、エトエートメチル(1134)+TX、エトキサゾール(320)+TX、エトリムホス(1142)+TX、フェナザフロル(1147)+TX、フェナザキン(328)+TX、酸化フェンブタスズ(330)+TX、フェノチオカルブ(337)+TX、フェンプロパトリン(342)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンピロキシメート(345)+TX、フェンソン(1157)+TX、フェントリファニル(1161)+TX、フェンバレレート(349)+TX、フィプロニル(354)+TX、フルアクリピリム(360)+TX、フルアズロン(1166)+TX、フルベンジミン(1167)+TX、フルシクロクスロン(366)+TX、フルシトリネート(367)+TX、フルエネチル(1169)+TX、フルフェノクスロン(370)+TX、フルメトリン(372)+TX、フルオルベンシド(1174)+TX、フルバリネート(1184)+TX、FMC1137(開発コード)(1185)+TX、ホルメタネート(405)+TX、ホルメタネートヒドロクロリド(405)+TX、ホルモチオン(1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、-HCH(430)+TX、グリオジン(1205)+TX、ハルフェンプロクス(424)+TX、ヘプテノホス(432)+TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1216)+TX、ヘキシチアゾクス(441)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、イソカルボホス(代替名)(473)+TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、ジャスモリンI(696)+TX、ジャスモリンII(696)+TX、ジヨドフェンホス(1248)+TX、リンダン(430)+TX、ルフェヌロン(490)+TX、マラチオン(492)+TX、マロノベン(1254)+TX、メカルバム(502)+TX、メホスフォラン(1261)+TX、メスルフェン(代替名)[CCN]+TX、メタクリホス(1266)+TX、メタミドホス(527)+TX、メチダチオン(529)+TX、メチオカルブ(530)+TX、メソミル(531)+TX、臭化メチル(537)+TX、メトルカルブ(550)+TX、メピンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミバホクス(1293)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、NC-512(化合物コード)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニッコマイシン(代替名)[CCN]+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラチオン(615)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホキシム(642)+TX、ピリミホス-メチル(652)+

10

20

30

40

50

TX、ポリクロロテルペン（慣習名）（1347）+ TX、ポリナクチン（代替名）（653）+ TX、プロクロノール（1350）+ TX、プロフェノホス（662）+ TX、プロマシル（1354）+ TX、プロバルギット（671）+ TX、プロペタムホス（673）+ TX、プロボキスル（678）+ TX、プロチダチオン（1360）+ TX、プロトエート（1362）+ TX、ピレトリンI（696）+ TX、ピレトリンII（696）+ TX、ピレトリン（696）+ TX、ピリダベン（699）+ TX、ピリダフェンチオン（701）+ TX、ピリミジフェン（706）+ TX、ピリミテート（1370）+ TX、キナルホス（711）+ TX、キンチオホス（1381）+ TX、R-1492（開発コード）（1382）+ TX、RA-17（開発コード）（1383）+ TX、ロテノン（722）+ TX、シュラダン（1389）+ TX、セブホス（代替名）+ TX、セラメクチン（代替名）[CCN]+ TX、SI-0009（化合物コード）+ TX、ソファミド（1402）+ TX、スピロジクロフェン（738）+ TX、スピロメシフェン（739）+ TX、SSI-121（開発コード）（1404）+ TX、スルフィラム（代替名）[CCN]+ TX、スルフラミド（750）+ TX、スルホテブ（753）+ TX、硫黄（754）+ TX、SZI-121（開発コード）（757）+ TX、フルバリネート（398）+ TX、テブフェンピラド（763）+ TX、TEPP（1417）+ TX、テルバム（代替名）+ TX、テトラクロルピンホス（777）+ TX、テトラジホン（786）+ TX、テトラナクチン（代替名）（653）+ TX、テトラスル（1425）+ TX、チアフェノクス（代替名）+ TX、チオカルボキシム（1431）+ TX、チオフアノックス（800）+ TX、チOMETON（801）+ TX、チオキノックス（1436）+ TX、ツリンギエンシン（代替名）[CCN]+ TX、トリアミホス（1441）+ TX、トリアラテン（1443）+ TX、トリアゾホス（820）+ TX、トリアズロン（代替名）+ TX、トリクロルホン（824）+ TX、トリフェノホス（1455）+ TX、トリナクチン（代替名）（653）+ TX、バミドチオン（847）+ TX、バニリプロール[CCN]およびYI-5302（化合物コード）+ TXからなる物質群から選択される殺ダニ剤、

ベトキサジン[CCN]+ TX、ニオクタノン酸銅（IUPAC名）（170）+ TX、硫酸銅（172）+ TX、シプトリン[CCN]+ TX、ジクロン（1052）+ TX、ジクロロフェン（232）+ TX、エンドタール（295）+ TX、フェンチン（347）+ TX、消石灰[CCN]+ TX、ナーバム（566）+ TX、キノクラミン（714）+ TX、キノンアミド（1379）+ TX、シマジン（730）+ TX、酢酸トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）および水酸化トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）+ TXから構成される物質群から選択される殺藻剤、

アバメクチン（1）+ TX、クルホメート（1011）+ TX、ドラメクチン（代替名）[CCN]+ TX、エマメクチン（291）+ TX、エマメクチン安息香酸塩（291）+ TX、エピリノメクチン（代替名）[CCN]+ TX、イベルメクチン（代替名）[CCN]+ TX、ミルベマイシンオキシム（代替名）[CCN]+ TX、モキシデクチン（代替名）[CCN]+ TX、ピペラジン[CCN]+ TX、セラメクチン（代替名）[CCN]+ TX、スピノサド（737）およびチオフアネート（1435）+ TXから構成される物質群から選択される駆虫薬、

クロラロース（127）+ TX、エンドリン（1122）+ TX、フェンチオン（346）+ TX、ピリジン-4-アミン（IUPAC名）（23）およびストリキニン（745）+ TXから構成される物質群から選択される殺鳥剤、

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン（IUPAC名）（1222）+ TX、4-（キノキサリン-2-イルアミノ）ベンゼンスルホンアミド（IUPAC名）（748）+ TX、8-硫酸ヒドロキシキノリン（446）+ TX、プロノポール（97）+ TX、ニオクタノン酸銅（IUPAC名）（170）+ TX、水酸化銅（IUPAC名）（169）+ TX、クレゾール[CCN]+ TX、ジクロロフェン（232）+ TX、ジピリチオン（1105）+ TX、ドジチン（1112）+ TX、フェナミノスルフ（1144）+ TX、ホルムアルデヒド（404）+ TX、ヒドラルガフェン（代替名）[CCN

10

20

30

40

50

] + TX、カスガマイシン(483) + TX、カスガマイシンヒドロクロリド水和物(483) + TX、ニッケルピス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(1308) + TX、ニトラピリン(580) + TX、オクチリノン(590) + TX、オキシリン酸(606) + TX、オキシテトラサイクリン(611) + TX、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム(446) + TX、プロベナゾール(658) + TX、ストレプトマイシン(744) + TX、ストレプトマイシンセスキスルフェート(744) + TX、テクロフタラム(766) + TX、およびチオメルサル(代替名)[CCN] + TXから構成される物質群から選択される殺バクテリア剤、

リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*) GV(代替名)(12) + TX、アグロバクテリウムラジオバクター(*Agrobacterium radiobacter*)(代替名)(13) + TX、アムプリセイウス属の一種(*Amblyseius spp.*)(代替名)(19) + TX、アナグラファファルシフェラ(*Anagrapha falcifera*) NPV(代替名)(28) + TX、アングルスアトムス(*Anagrus atomus*)(代替名)(29) + TX、アブラコバチ(*Aphelinus abdominalis*)(代替名)(33) + TX、コレマンアブラバチ(*Aphidius colemani*)(代替名)(34) + TX、ショクガタマバエ(*Aphidoletes aphidimyza*)(代替名)(35) + TX、オートグラファカリホルニカ(*Autographa californica* NPV)(代替名)(38) + TX、バシラスフィルムス(*Bacillus firmus*)(代替名)(48) + TX、バシラススファエリクス(*Bacillus sphaericus* Neide)(学名)(49) + TX、バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* Berliner)(学名)(51) + TX、バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)(学名)(51) + TX、バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*)(学名)(51) + TX、バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*)(学名)(51) + TX、バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)(学名)(51) + TX、バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*)(学名)(51) + TX、ベアウベリアバッシアナ(*Beauveria bassiana*)(代替名)(53) + TX、ベアウベリアブロングニアルチイ(*Beauveria brongniartii*)(代替名)(54) + TX、ヤマトクサカゲロウ(*Chrysoperla carnea*)(代替名)(151) + TX、ツマアカオオヒメテントウ(*Cryptolaemus montrouzieri*)(代替名)(178) + TX、コドリンガ(*Cydia pomonella*) GV(代替名)(191) + TX、ハモグリコマユバチ(*Dacnusa sibirica*)(代替名)(212) + TX、イサエアヒメコバチ(*Diglyphus isaea*)(代替名)(254) + TX、オンシツツヤコバチ(*Encarsia formosa*)(学名)(293) + TX、サバクツヤコバチ(*Eretmocerus eremicus*)(代替名)(300) + TX、アメリカタバコガ(*Helicoverpa zea*) NPV(代替名)(431) + TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ(*Heterorhabditis bacteriophora*)およびH. メギジス(*H. megidis*)(代替名)(433) + TX、ヒポダミアコンベルゲンス(*Hippodamia convergens*)(代替名)(442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ(*Leptomastix dactylopii*)(代替名)(488) + TX、マクロロフスカリジノサス(*Macrolophus caliginosus*)(代替名)(491) + TX、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*) NPV(代替名)(494) + TX、メタフィクスヘルボルス(*Metaphycus helvolus*)(代替名)(522) + TX、メタリジウムアニソプリアエ(*Metarhizium anisopliae*

10

20

30

40

50

var. acridum) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (Metarhizium anisopliae var. anisopliae) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (Neodiprion sertifer NPV) および N. レコンテイ (N. lecontei NPV) (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属の一種 (Orius spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (Spodoptera exigua) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイネルネマビビオニス (Steinernema bibionis) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマカルポカプサエ (Steinernema carpocapsae) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマフェルチアエ (Steinernema feltiae) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマグラセリ (Steinernema glaseri) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラエ b (Steinernema riobrave) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラビス (Steinernema riobravis) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマスカプテリスキ (Steinernema scapterisci) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ属の一種 (Steinernema spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属の一種 (Trichogramma spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (Typhlodromus occidentalis) (代替名) (844) およびベルチシリウムレカニイ (Verticillium lecanii) (代替名) (848) + TX、パチルスサブチリス var. アミロリクエファシエンス (Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens) 菌株 FZB24 (Novozymes Biologicals Inc. (5400 Corporate Circle, Salem, VA 24153, U.S.A.) から入手可能であり、および、商品名 Taegro (登録商標) で公知である) + TX から構成される物質群から選択される生物剤、

10

20

30

ヨードメタン (IUPAC 名) (542) および臭化メチル (537) + TX から構成される物質群から選択される土壌不毛剤、

アホレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘムバ [CCN] + TX、メテバ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テバ [CCN] + TX、チオヘムバ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] およびウレデパ (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される不妊化剤、

(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートを伴う (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC 名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナル (IUPAC 名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (438) + TX、(Z) - イコス - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC 名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アル (IUPAC 名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテ

40

50

ト ( I U P A C 名 ) ( 7 8 4 ) + T X、 ( 7 E , 9 Z ) - ドデカ - 7 , 9 - ジエン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 2 8 3 ) + T X、 ( 9 Z , 1 1 E ) - テトラデカ - 9 , 1 1 - ジエン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 7 8 0 ) + T X、 ( 9 Z , 1 2 E ) - テトラデカ - 9 , 1 2 - ジエン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 7 8 1 ) + T X、 1 4 - メチルオクタデカ - 1 - エン ( I U P A C 名 ) ( 5 4 5 ) + T X、 4 - メチルノナン - 5 - オールを伴う 4 - メチルノナン - 5 - オン ( I U P A C 名 ) ( 5 4 4 ) + T X、 - ムルチストリアチン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 プレビコミン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 コドレルレ ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 コドレモン ( 代替名 ) ( 1 6 7 ) + T X、 クエルレ ( 代替名 ) ( 1 7 9 ) + T X、 ジスパールア ( 2 7 7 ) + T X、 ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 2 8 6 ) + T X、 ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 2 8 7 ) + T X、 ドデカ - 8 + T X、 1 0 - ジエン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 2 8 4 ) + T X、 ドミニカルア ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 エチル 4 - メチルオクタノエート ( I U P A C 名 ) ( 3 1 7 ) + T X、 オイゲノール ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 フロントリン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 ゴシップルア ( 代替名 ) ( 4 2 0 ) + T X、 グランドルア ( 4 2 1 ) + T X、 グランドルア I ( 代替名 ) ( 4 2 1 ) + T X、 グランドルア I I ( 代替名 ) ( 4 2 1 ) + T X、 グランドルア I V ( 代替名 ) ( 4 2 1 ) + T X、 ヘキサルア [ C C N ] + T X、 イブスジエノール ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 イブセノール ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 ジャボニルア ( 代替名 ) ( 4 8 1 ) + T X、 リネアチン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 リトルア ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 ルーブルア ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 メドルア [ C C N ] + T X、 メガトモ酸 ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 メチルオイゲノール ( 代替名 ) ( 5 4 0 ) + T X、 ムスカルア ( 5 6 3 ) + T X、 オクタデカ - 2 , 1 3 - ジエン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 5 8 8 ) + T X、 オクタデカ - 3 , 1 3 - ジエン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 5 8 9 ) + T X、 オルフラルア ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 オリクタルア ( 代替名 ) ( 3 1 7 ) + T X、 オストラモン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 シグルア [ C C N ] + T X、 ソルジジン ( 代替名 ) ( 7 3 6 ) + T X、 スルカトール ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 テトラデカ - 1 1 - エン - 1 - イルアセテート ( I U P A C 名 ) ( 7 8 5 ) + T X、 トリメドルア ( 8 3 9 ) + T X、 トリメドルア A ( 代替名 ) ( 8 3 9 ) + T X、 トリメドルア B 1 ( 代替名 ) ( 8 3 9 ) + T X、 トリメドルア B 2 ( 代替名 ) ( 8 3 9 ) + T X、 トリメドルア C ( 代替名 ) ( 8 3 9 ) およびトランクコール ( 代替名 ) [ C C N ] + T X から構成される物質群から選択される昆虫フェロモン、

2 - ( オクチルチオ ) - エタノール ( I U P A C 名 ) ( 5 9 1 ) + T X、 ブトピロノキシル ( 9 3 3 ) + T X、 ブトキシ ( ポリプロピレングリコール ) ( 9 3 6 ) + T X、 ジブチルアジベート ( I U P A C 名 ) ( 1 0 4 6 ) + T X、 フタル酸ジブチル ( 1 0 4 7 ) + T X、 ジブチルコハク酸塩 ( I U P A C 名 ) ( 1 0 4 8 ) + T X、 ジエチルトルアミド [ C C N ] + T X、 ジメチルカルベート [ C C N ] + T X、 ジメチルフタレート [ C C N ] + T X、 エチルヘキサンジオール ( 1 1 3 7 ) + T X、 ヘキサミド [ C C N ] + T X、 メトキンブチル ( 1 2 7 6 ) + T X、 メチルネオデカンアミド [ C C N ] + T X、 オキサメート [ C C N ] およびピカリジン [ C C N ] + T X から構成される物質群から選択される昆虫忌避剤、

1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン ( I U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名 ) ( 1 0 5 8 ) + T X、 1 , 1 - ジクロロ - 2 , 2 - ビス ( 4 - エチルフェニル ) エタン ( I U P A C 名 ) ( 1 0 5 6 )、 + T X、 1 , 2 - ジクロロプロパン ( I U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名 ) ( 1 0 6 2 ) + T X、 1 , 3 - ジクロロプロパンを伴う 1 , 2 - ジクロロプロパン ( I U P A C 名 ) ( 1 0 6 3 ) + T X、 1 - プロモ - 2 - クロロエタン ( I U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名 ) ( 9 1 6 ) + T X、 2 , 2 , 2 - トリクロロ - 1 - ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) 酢酸エチル ( I U P A C 名 ) ( 1 4 5 1 ) + T X、 2 , 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルリン酸 ( I U P A C 名 ) ( 1 0 6 6 ) + T X、 2 - ( 1 , 3 - ジチオラン - 2 -

10

20

30

40

50

イル)フェニルジメチルカルバメート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1109)+TX、2-(2-プトキシエトキシ)エチルチオシアネート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(935)+TX、2-(4,5-ジメチル-1,3-ジオキソラン-2-イル)フェニルメチルカルバメート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1084)+TX、2-(4-クロロ-3,5-キシリルオキシ)エタノール(IUPAC名)(986)+TX、2-クロロビニルジエチルリン酸(IUPAC名)(984)+TX、2-イミダゾリドン(IUPAC名)(1225)+TX、2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246)+TX、2-メチル(プロブ-2-イニル)アミノフェニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1284)+TX、2-チオシアナトエチルラウレート(IUPAC名)(1433)+TX、3-プロモ-1-クロロプロブ-1-エン(IUPAC名)(917)+TX、3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イルジメチルカルバメート(IUPAC名)(1283)+TX、4-メチル(プロブ-2-イニル)アミノ-3,5-キシリルメチルカルバメート(IUPAC名)(1285)+TX、5,5-ジメチル-3-オキソシクロヘキサ-1-エニルジメチルカルバメート(IUPAC名)(1085)+TX、アパメクチン(1)+TX、アセフェート(2)+TX、アセタミプリド(4)+TX、アセチオン(代替名)[CCN]+TX、アセトブロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アクリロニトリル(IUPAC名)(861)+TX、アラニカルブ(15)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、アルドリル(864)+TX、アレトリン(17)+TX、アロサミジン(代替名)[CCN]+TX、アリキシカルブ(866)+TX、  
 -シペルメトリン(202)+TX、  
 -エクジソン(代替名)[CCN]+TX、リン化マグネシウム(640)+TX、アミジチオン(870)+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミノカルブ(873)+TX、アミトン(875)+TX、シュウ酸水素アミトン(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アナバシン(877)+TX、アチダチオン(883)+TX、AVI382(化合物コード)+TX、AZ60541(化合物コード)+TX、アザジラクチン(代替名)(41)+TX、アザメチホス(42)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾトエート(889)+TX、パチルスチューリンゲンシス(Bacillus thuringiensis) エンドトキシン(代替名)(52)+TX、バリウムヘキサフルオロシリケート(代替名)[CCN]+TX、バリウムポリスルフィド(IUPAC/Chemical Abstracts名)(892)+TX、バルトリン[CCN]+TX、バイエル22/190(開発コード)(893)+TX、バイエル22408(開発コード)(894)+TX、ベンジオカルブ(58)+TX、ベンフラカルブ(60)+TX、ベンサルタップ(66)+TX、  
 -シフルトリン(194)+TX、  
 -シペルメトリン(203)+TX、ピフェントリン(76)+TX、ピオアレトリン(78)+TX、ピオアレトリンS-シクロペンテニル異性体(代替名)(79)+TX、バイオエタノメトリン[CCN]+TX、ピオパーメトリン(908)+TX、ピオレスメトリン(80)+TX、ピス(2-クロロエチル)エーテル(IUPAC名)(909)+TX、ピストリフルロン(83)+TX、ホウ酸ナトリウム(86)+TX、プロフェンバレレート(代替名)+TX、プロムフェンピンホス(914)+TX、プロモシクレン(918)+TX、プロモ-DDT(代替名)[CCN]+TX、プロモホス(920)+TX、プロモホス-エチル(921)+TX、プフェンカルブ(924)+TX、ブプロフェジン(99)+TX、ブタカルブ(926)+TX、ブタチオホス(927)+TX、プトカルボキシム(103)+TX、プトネート(932)+TX、プトキシカルボキシム(104)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、カズサホス(109)+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、シアン化カルシウム(444)+TX、多硫酸カルシウム(IUPAC名)(111)+TX、カンフェクロール(941)+TX、カルバノレート(943)+TX、カルパリル(115)+TX、カルボフラン(118)+TX、二硫化炭素(IUPAC/Chemical Abstracts名)(945)+TX

10

20

30

40

50

、四塩化炭素 ( I U P A C 名 ) ( 9 4 6 ) + T X 、カルボフェノチオン ( 9 4 7 ) + T X  
 、カルボスルファン ( 1 1 9 ) + T X 、カルタップ ( 1 2 3 ) + T X 、カルタップヒドロ  
 クロリド ( 1 2 3 ) + T X 、セバジン ( 代替名 ) ( 7 2 5 ) + T X 、クロルビシクレン ( 9 6 0 ) + T X 、クロルダン ( 1 2 8 ) + T X 、クロルデコン ( 9 6 3 ) + T X 、クロル  
 ジメホルム ( 9 6 4 ) + T X 、クロルジメホルムヒドロクロリド ( 9 6 4 ) + T X 、クロ  
 ルエトキシホス ( 1 2 9 ) + T X 、クロルフェナピル ( 1 3 0 ) + T X 、クロルフェンピ  
 ンホス ( 1 3 1 ) + T X 、クロルフルアズロン ( 1 3 2 ) + T X 、クロルメホス ( 1 3 6 )  
 ) + T X 、クロロホルム [ C C N ] + T X 、クロルピクリン ( 1 4 1 ) + T X 、クロルホ  
 キシム ( 9 8 9 ) + T X 、クロルプラゾホス ( 9 9 0 ) + T X 、クロルピリホス ( 1 4 5 )  
 ) + T X 、クロルピリホス - メチル ( 1 4 6 ) + T X 、クロルチオホス ( 9 9 4 ) + T X 10  
 、クロマフェノジド ( 1 5 0 ) + T X 、シネリン I ( 6 9 6 ) + T X 、シネリン I I ( 6  
 9 6 ) + T X 、シネリンス ( 6 9 6 ) + T X 、 c i s - レスメスリン ( 代替名 ) + T X 、  
 シスメトリン ( 8 0 ) + T X 、クロシトリン ( 代替名 ) + T X 、クロエトカルブ ( 9 9 9 )  
 ) + T X 、クロサンテル ( 代替名 ) [ C C N ] + T X 、クロチアニジン ( 1 6 5 ) + T X  
 、アセト亜ヒ酸銅 [ C C N ] + T X 、ヒ酸銅 [ C C N ] + T X 、オレイン酸銅 [ C C N ]  
 + T X 、クマホス ( 1 7 4 ) + T X 、クミトエート ( 1 0 0 6 ) + T X 、クロタミトン ( 代  
 替名 ) [ C C N ] + T X 、クロトキシホス ( 1 0 1 0 ) + T X 、クルホメート ( 1 0 1  
 1 ) + T X 、氷晶石 ( 代替名 ) ( 1 7 7 ) + T X 、 C S 7 0 8 ( 開発コード ) ( 1 0 1 2 )  
 ) + T X 、シアノフェンホス ( 1 0 1 9 ) + T X 、シアノホス ( 1 8 4 ) + T X 、シアン  
 トエート ( 1 0 2 0 ) + T X 、シクレトリン [ C C N ] + T X 、シクロプロトリン ( 1 8 20  
 8 ) + T X 、シフルトリン ( 1 9 3 ) + T X 、シハロトリン ( 1 9 6 ) + T X 、シベルメ  
 トリン ( 2 0 1 ) + T X 、シフェノトリン ( 2 0 6 ) + T X 、シロマジン ( 2 0 9 ) + T  
 X 、シチオエート ( 代替名 ) [ C C N ] + T X 、 d - リモネン ( 代替名 ) [ C C N ] + T  
 X 、 d - テトラメトリン ( 代替名 ) ( 7 8 8 ) + T X 、 D A E P ( 1 0 3 1 ) + T X 、ダ  
 ゴメット ( 2 1 6 ) + T X 、 D D T ( 2 1 9 ) + T X 、デカルボフラン ( 1 0 3 4 ) + T  
 X 、デルタメトリン ( 2 2 3 ) + T X 、デメフィオン ( 1 0 3 7 ) + T X 、デメフィオン  
 - O ( 1 0 3 7 ) + T X 、デメフィオン - S ( 1 0 3 7 ) + T X 、デメトン ( 1 0 3 8 )  
 ) + T X 、デメトン - メチル ( 2 2 4 ) + T X 、デメトン - O ( 1 0 3 8 ) + T X 、デメト  
 ン - O - メチル ( 2 2 4 ) + T X 、デメトン - S ( 1 0 3 8 ) + T X 、デメトン - S - メ  
 チル ( 2 2 4 ) + T X 、デメトン - S - メチルスルホン ( 1 0 3 9 ) + T X 、ジアフェン 30  
 チウロン ( 2 2 6 ) + T X 、ジアリホス ( 1 0 4 2 ) + T X 、ジアミダホス ( 1 0 4 4 )  
 ) + T X 、ダイアジノン ( 2 2 7 ) + T X 、ジカプトン ( 1 0 5 0 ) + T X 、ジクロロフェ  
 ンチオン ( 1 0 5 1 ) + T X 、ジクロルボス ( 2 3 6 ) + T X 、ジクリホス ( 代替名 ) +  
 T X 、ジクレシル ( 代替名 ) [ C C N ] + T X 、ジクロトホス ( 2 4 3 ) + T X 、ジシク  
 ラニル ( 2 4 4 ) + T X 、ディルドリン ( 1 0 7 0 ) + T X 、ジエチル 5 - メチルピラゾ  
 ール - 3 - イルリン酸塩 ( I U P A C 名 ) ( 1 0 7 6 ) + T X 、ジフルベンズロン ( 2 5  
 0 ) + T X 、ジロール ( 代替名 ) [ C C N ] + T X 、ジメフルトリン [ C C N ] + T X 、  
 ジメホクス ( 1 0 8 1 ) + T X 、ジメタン ( 1 0 8 5 ) + T X 、ジメトエート ( 2 6 2 )  
 ) + T X 、ジメトリン ( 1 0 8 3 ) + T X 、ジメチルピンホス ( 2 6 5 ) + T X 、ジメチラ  
 ン ( 1 0 8 6 ) + T X 、ジネクス ( 1 0 8 9 ) + T X 、ジネクスジクレキシ ( 1 0 8 9 40  
 ) + T X 、ジノプロブ ( 1 0 9 3 ) + T X 、ジノサム ( 1 0 9 4 ) + T X 、ジノセブ ( 1  
 0 9 5 ) + T X 、ジノテフラン ( 2 7 1 ) + T X 、ジオフェノラン ( 1 0 9 9 ) + T X 、  
 ジオキサベンゾホス ( 1 1 0 0 ) + T X 、ジオキサカルブ ( 1 1 0 1 ) + T X 、ジオキサ  
 チオン ( 1 1 0 2 ) + T X 、ジスルホトン ( 2 7 8 ) + T X 、ジチクロホス ( 1 1 0 8 )  
 ) + T X 、 D N O C ( 2 8 2 ) + T X 、ドラメクチン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X 、 D S P  
 ( 1 1 1 5 ) + T X 、エクジステロン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X 、 E I 1 6 4 2 ( 開発  
 コード ) ( 1 1 1 8 ) + T X 、エマメクチン ( 2 9 1 ) + T X 、エマメクチン安息香酸塩  
 ( 2 9 1 ) + T X 、 E M P C ( 1 1 2 0 ) + T X 、エムペントリン ( 2 9 2 ) + T X 、エ  
 ンドスルファン ( 2 9 4 ) + T X 、エンドチオン ( 1 1 2 1 ) + T X 、エンドリン ( 1 1  
 2 2 ) + T X 、 E P B P ( 1 1 2 3 ) + T X 、 E P N ( 2 9 7 ) + T X 、エポフェノナン 50

(1124) + TX、エピリノメクチン(代替名) [CCN] + TX、エスフェンバレレート(302) + TX、エタホス(代替名) [CCN] + TX、エチオフエンカルブ(308) + TX、エチオン(309) + TX、エチプロール(310) + TX、エトエートメチル(1134) + TX、エトプロホス(312) + TX、ギ酸エチル(IUPAC名) [CCN] + TX、エチル-DDD(代替名)(1056) + TX、エチレンジプロミド(316) + TX、ジクロロエタン(化学名)(1136) + TX、エチレンオキシド [CCN] + TX、エトフェンブックス(319) + TX、エトリムホス(1142) + TX、EXD(1143) + TX、ファンファー(323) + TX、フェナミホス(326) + TX、フェナザフロル(1147) + TX、フェンクロールホス(1148) + TX、フェネタカルブ(1149) + TX、フェンフルトリン(1150) + TX、フェニトクロチオン(335) + TX、フェノブカルブ(336) + TX、フェノキサクリム(1153) + TX、フェノキシカルブ(340) + TX、フェンピリトリン(1155) + TX、フェンプロパトリン(342) + TX、フェンピラド(代替名) + TX、フェンスルホチオン(1158) + TX、フェンチオン(346) + TX、フェンチオン-エチル [CCN] + TX、フェンバレレート(349) + TX、フィプロニル(354) + TX、フロニカミド(358) + TX、フルベンジアミド(CAS登録番号: 272451-65-7) + TX、フルコフロン(1168) + TX、フルシクロクスロン(366) + TX、フルシトリネート(367) + TX、フルエネチル(1169) + TX、フルフェネリム [CCN] + TX、フルフェノクスロン(370) + TX、フルフェンブックス(1171) + TX、フルメトリン(372) + TX、フルバリネート(1184) + TX、FMC1137(開発コード)(1185) + TX、フォノホス(1191) + TX、ホルメタネート(405) + TX、ホルメタネートヒドロクロリド(405) + TX、ホルモチオン(1192) + TX、ホルムパラネート(1193) + TX、ホスメチラン(1194) + TX、ホスピレート(1195) + TX、ホスチアゼート(408) + TX、ホスチエタン(1196) + TX、フラチオカルブ(412) + TX、フレトリン(1200) + TX、  
-シハロトリン(197) + TX、  
-HCH(430) + TX、  
グアザチン(422) + TX、グアザチン酢酸塩(422) + TX、GY-81(開発コード)(423) + TX、ハルフェンブックス(424) + TX、ハロフェノジド(425) + TX、HCH(430) + TX、HEOD(1070) + TX、ヘブタクロール(1211) + TX、ヘプテノホス(432) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヘキサフルムロン(439) + TX、HHDN(864) + TX、ヒドラメチルノン(443) + TX、シアン化水素(444) + TX、ヒドロブレン(445) + TX、ヒキンカルブ(1223) + TX、イミダクロプリド(458) + TX、イミプロトリン(460) + TX、インドキサカルブ(465) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、IPSP(1229) + TX、イサゾホス(1231) + TX、イソベンザン(1232) + TX、イソカルボホス(代替名)(473) + TX、イソドリン(1235) + TX、イソフェンホス(1236) + TX、イソラン(1237) + TX、イソプロカルブ(472) + TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473) + TX、イソプロチオラン(474) + TX、イソチオエート(1244) + TX、イソキサチオン(480) + TX、イベルメクチン(代替名) [CCN] + TX、ジャスモリンI(696) + TX、ジャスモリンII(696) + TX、ジヨドフェンホス(1248) + TX、幼虫ホルモンI(代替名) [CCN] + TX、幼虫ホルモンII(代替名) [CCN] + TX、幼虫ホルモンIII(代替名) [CCN] + TX、ケレバン(1249) + TX、キノブレン(484) + TX、ラムダ-シハロトリン(198) + TX、砒酸鉛 [CCN] + TX、レピメクチン(CCN) + TX、レプトホス(1250) + TX、リンダン(430) + TX、リリムホス(1251) + TX、ルフエヌロン(490) + TX、リチダチオン(1253) + TX、m-クメニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1014) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、マラチオン(492) + TX、マロノベン(1254) + TX、マジドクス(1255) + TX、メカルバム(502) + TX、メカルホン(125

10

20

30

40

50

8) + TX、メナゾン (1260) + TX、メホスフォラン (1261) + TX、塩化第一水銀 (513) + TX、メスルフェンホス (1263) + TX、メタフルミゾン (CCN) + TX、メタム (519) + TX、メタム - カリウム (代替名) (519) + TX、メタム - ナトリウム (519) + TX、メタクリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、フッ化メタンスルホニル (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1268) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メトクロトホス (1273) + TX、メソミル (531) + TX、メトブレ (532) + TX、メトキンブチル (1276) + TX、メトトリン (代替名) (533) + TX、メトキシクロル (534) + TX、メトキシフェノジド (535) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、メチルクロロホルム (代替名) [CCN] + TX、塩化メチレン [CCN] + TX、メトフルトリン [CCN] + TX、メトルカルブ (550) + TX、メトキサジアゾン (1288) + TX、メピンホス (556) + TX、メキサカルベート (1290) + TX、ミルベメクチン (557) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、ミバホクス (1293) + TX、ミレックス (1294) + TX、モノクロトホス (561) + TX、モルホチオン (1300) + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ナフタロホス (代替名) [CCN] + TX、ナレド (567) + TX、ナフタレン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1303) + TX、NC - 170 (開発コード) (1306) + TX、NC - 184 (化合物コード) + TX、ニコチン (578) + TX、ニコチンスルフェート (578) + TX、ニフルリジド (1309) + TX、ニテンピラム (579) + TX、ニチアジン (1311) + TX、ニトリラカルブ (1313) + TX、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 (1313) + TX、NNI - 0101 (化合物コード) + TX、NNI - 0250 (化合物コード) + TX、ノルニコチン (慣習名) (1319) + TX、ノバルロン (585) + TX、ノピフルムロン (586) + TX、O - 5 - ジクロロ - 4 - ヨードフェニル O - エチルエチルホスホノチオエート (IUPAC 名) (1057) + TX、O, O - ジエチル O - 4 - メチル - 2 - オキソ - 2H - クロメン - 7 - イルホスホロチオネート (IUPAC 名) (1074) + TX、O, O - ジエチル O - 6 - メチル - 2 - プロピルピリミジン - 4 - イルホスホロチオネート (IUPAC 名) (1075) + TX、O, O, O', O' - テトラプロピルジチオピロホスフェート (IUPAC 名) (1424) + TX、オレイン酸 (IUPAC 名) (593) + TX、オメトエート (594) + TX、オキサミル (602) + TX、オキシデメトン - メチル (609) + TX、オキシデプロホス (1324) + TX、オキシジスルホトン (1325) + TX、pp' - DDT (219) + TX、パラ - ジクロロベンゼン [CCN] + TX、パラチオン (615) + TX、パラチオン - メチル (616) + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、ペンタクロロフェノール (623) + TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル (IUPAC 名) (623) + TX、ペルメトリン (626) + TX、石油 (代替名) (628) + TX、PH60 - 38 (開発コード) (1328) + TX、フェンカプトン (1330) + TX、フェノトリン (630) + TX、フェントエート (631) + TX、ホレート (636) + TX、ホサロン (637) + TX、ホスホラン (1338) + TX、ホスメット (638) + TX、ホスニクロル (1339) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスフィン (IUPAC 名) (640) + TX、ホキシム (642) + TX、ホキシム - メチル (1340) + TX、ピリメタホス (1344) + TX、ピリミカーブ (651) + TX、ピリミホス - エチル (1345) + TX、ピリミホス - メチル (652) + TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体 (IUPAC 名) (1346) + TX、ポリクロロテルペン (慣習名) (1347) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、カリウムチオシアネート [CCN] + TX、プラレトリン (655) + TX、プレコセン I (代替名) [CCN] + TX、プレコセン II (代替名) [CCN] + TX、プレコセン III (代替名) [CCN] + TX、プリミドホス (1349) + TX、プロフェノホス (662) + TX、プロフルトリン [CCN] + TX、プロマシル (1354) + TX、プロメカルブ (1355) + TX、プロバ

10

20

30

40

50

ホス(1356)+TX、プロペタムホス(673)+TX、プロボキスル(678)+TX、  
 TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロチオホス(686)+TX、プロトエー  
 ト(1362)+TX、プロトリフェンブト[CCN]+TX、ピメトロジン(688)  
 +TX、ピラクロホス(689)+TX、ピラゾホス(693)+TX、ピレスメトリン  
 (1367)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX  
 、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダリル(700)+  
 TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミ  
 テート(1370)+TX、ピリプロキシフェン(708)+TX、カシヤ(代替名)  
 [CCN]+TX、キナルホス(711)+TX、キナルホス-メチル(1376)+T  
 X、キノチオン(1380)+TX、キンチオホス(1381)+TX、R-1492( 10  
 開発コード)(1382)+TX、ラホキサニド(代替名)[CCN]+TX、レスメス  
 リン(719)+TX、ロテノン(722)+TX、RU15525(開発コード)(7  
 23)+TX、RU25475(開発コード)(1386)+TX、リアニア(代替名)  
 (1387)+TX、リアノジン(慣習名)(1387)+TX、サバジラ(代替名)(  
 725)+TX、シュラダン(1389)+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメク  
 チン(代替名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、SI-02  
 05(化合物コード)+TX、SI-0404(化合物コード)+TX、SI-0405  
 (化合物コード)+TX、シラフルオフエン(728)+TX、SN72129(開発コ  
 ード)(1397)+TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN]+TX、シアン化ナトリウム( 20  
 444)+TX、ナトリウムフッ化物(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1399)+TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400)+TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩(623)+TX、セレン酸ナトリウム(IUPAC名)(1401)+TX、チオシアン酸ナトリウム[CCN]+TX、ソファミド(1402)+TX、スピノサド(737)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、スピロテトラマト(CCN)+TX、スルコフロン(746)+TX、スルコフロン-ナトリウム(746)+TX、スルフラミド(750)+TX、スルホテブ(753)+TX、スルフルルフッ化物(756)+TX、スルプロホス(1408)+TX、タール油(代替名)(758)+TX、-フルバリネート(398)+TX、チオナジン(1412)+TX、TDE(1414)+TX、テブフェノジド(762)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、テブピリムホス(764)+TX、テフルベンズロン(768 30  
 )+TX、テフルトリン(769)+TX、テメホス(770)+TX、TEPP(1417)+TX、テラレスリン(1418)+TX、テルバム(代替名)+TX、テルブホス(773)+TX、テトラクロロエタン[CCN]+TX、テトラクロルピンホス(777)+TX、テトラメトリン(787)+TX、-シベルメトリン(204)+TX、チアクロプリド(791)+TX、チアフェノクス(代替名)+TX、チアメトキサム(792)+TX、チクロホス(1428)+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオシクラム(798)+TX、チオシクラム水素オキサレート(798)+TX、チオジカルブ(799)+TX、チオフアノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオナジン(1434)+TX、チオスルタップ(803)+TX、チオスルタップ-ナトリウム(803)+TX、ツリングエンシン(代替名)[CCN]+TX 40  
 、トルフェンピラド(809)+TX、トラロメトリン(812)+TX、トランスフルトリン(813)+TX、トランスパーメトリン(1440)+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアザメート(818)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、トリクロルホン(824)+TX、トリクロルメタホス-3(代替名)[CCN]+TX、トリクロロナト(1452)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリフルムロン(835)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、トリブレン(1459)+TX、パミドチオン(847)+TX、パニリプロール[CCN]+TX、ベラトリジン(代替名)(725)+TX、ベラトリン(代替名)(725)+TX、XMC(853)+TX、キシリルカルブ(854)+TX、YI-5302(化合物コード)+TX、-シベルメトリン(205)+TX、メトリン(代替名 50

) + TX、亜鉛ホスフィド (640) + TX、ゾラプロホス (1469) および ZXI 8901 (開発コード) (858) + TX、シアントラニリプロール [736994 - 63 - 19 + TX、クロラントラニリプロール [500008 - 45 - 7] + TX、シエノピラフェン [560121 - 52 - 0] + TX、シフルメトフェン [400882 - 07 - 7] + TX、ピリフルキナゾン [337458 - 27 - 2] + TX、スピネトラム [187166 - 40 - 1 + 187166 - 15 - 0] + TX、スピロテトラマト [203313 - 25 - 1] + TX、スルホキサフロル [946578 - 00 - 3] + TX、フルフィプロール [704886 - 18 - 0] + TX、メペルフルトリン [915288 - 13 - 0] + TX、テトラメチルフルトリン [84937 - 88 - 2] + TX、トリフルメゾピリン (国際公開第2012/092115号に開示されている) + TX からなる物質群から選択される殺虫剤、

10

ビス(トリブチルスズ)オキシド (IUPAC名) (913) + TX、プロモアセタミド [CCN] + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + TX、クロエトカルブ (999) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、硫酸銅 (172) + TX、フェンチン (347) + TX、第二鉄リン酸 (IUPAC名) (352) + TX、メタルデヒド (518) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ニクロスアミド (576) + TX、ニクロスアミドオラミン (576) + TX、ペンタクロロフェノール (623) + TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩 (623) + TX、チオナジン (1412) + TX、チオジカルブ (799) + TX、酸化トリブチルスズ (913) + TX、トリフェンモルフ (1454) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) および水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX、ピリプロール [394730 - 71 - 3] + TX から構成される物質群から選択される殺軟体動物剤、

20

AKD - 3088 (化合物コード) + TX、1, 2 - ジブromo - 3 - クロロプロパン (IUPAC / Chemical Abstracts名) (1045) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / Chemical Abstracts名) (1062) + TX、1, 2 - ジクロロプロパンを伴う1, 3 - ジクロロプロペン (IUPAC名) (1063) + TX、1, 3 - ジクロロプロペン (233) + TX、3, 4 - ジクロロテトラヒドロチオフェン1, 1 - ジオキシド (IUPAC / Chemical Abstracts名) (1065) + TX、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルロダニン (IUPAC名) (980) + TX、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1, 3, 5 - チアジアジナン - 3 - イル酢酸 (IUPAC名) (1286) + TX、6 - イソペンテニルアミノプリン (代替名) (210) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、AZ60541 (化合物コード) + TX、ベンクロチアズ [CCN] + TX、ベノミル (62) + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (945) + TX、カルボスルファン (119) + TX、クロルピクリン (141) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロエトカルブ (999) + TX、サイトカイニン (代替名) (210) + TX、ダゾメット (216) + TX、DBC P (1045) + TX、DCIP (218) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ジクロロフェンチオン (1051) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジメトエート (262) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エピリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エトプロホス (312) + TX、エチレンジブromid (316) + TX、フェナミホス (326) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158) + TX、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、ルフラール (代替名) [CCN] + TX、GY - 81 (開発コード) (423) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イサミドホス (1230) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、カイネチン (代替名) (

30

40

50

210) + TX、メカルホン(1258) + TX、メタム(519) + TX、メタムカリウム(代替名)(519) + TX、メタムナトリウム(519) + TX、臭化メチル(537) + TX、メチルイソチオシアネート(543) + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + TX、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、ミロテシウムベルカリア(*Myrothecium verrucaria*)組成物(代替名)(565) + TX、NC-184(化合物コード) + TX、オキサミル(602) + TX、ホレート(636) + TX、ホスファミドン(639) + TX、ホスホカルブ[CCN] + TX、セブホス(代替名) + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、スピノサド(737) + TX、テルバム(代替名) + TX、テルブホス(773) + TX、テトラクロロチオフェン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1422) + TX、チアフェノクス(代替名) + TX、チオナジン(1434) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、キシレノルス[CCN] + TX、YI-5302(化合物コード)およびゼアチン(代替名)(210) + TX、フルエンズルホン[318290-98-1] + TXから構成される物質群から選択される殺線虫剤、

エチルキサントゲン酸カリウム[CCN]およびニトラピリン(580) + TXから構成される物質群から選択される硝化抑制剤、

アシベンゾラル(6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル(6) + TX、プロベナゾール(658)およびオオイタドリ(*Reynoutria sachalinensis*)抽出物(代替名)(720) + TXから構成される物質群から選択される植物活性化剤、

2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246) + TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748) + TX、-クロロヒドリン[CCN] + TX、リン化アルミニウム(640) + TX、アンツ(880) + TX、三酸化ヒ素(882) + TX、炭酸バリウム(891) + TX、ビスチオセミ(912) + TX、プロジファクム(89) + TX、プロマジオロン(91) + TX、プロメタリン(92) + TX、シアン化カルシウム(444) + TX、クロラース(127) + TX、クロロファシノン(140) + TX、コレカルシフェロール(代替名)(850) + TX、クマクロル(1004) + TX、クマフリル(1005) + TX、クマテトラリル(175) + TX、クリミジン(1009) + TX、ジフェナクム(246) + TX、ジフェチアロン(249) + TX、ジファシノン(273) + TX、エルゴカルシフェロール(301) + TX、フロクマフェン(357) + TX、フルオロアセタミド(379) + TX、フルプロバジン(1183) + TX、フルプロバジンヒドロクロリド(1183) + TX、-HCH(430) + TX、HCH(430) + TX、シアン化水素(444) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、リンダン(430) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、臭化メチル(537) + TX、ノルボルミド(1318) + TX、ホスアセチム(1336) + TX、ホスフィン(IUPAC名)(640) + TX、リン[CCN] + TX、ピンドン(1341) + TX、亜ヒ酸カリウム[CCN] + TX、ピリヌロン(1371) + TX、シリロシド(1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN] + TX、シアン化ナトリウム(444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム(735) + TX、ストリキニン(745) + TX、硫酸タリウム[CCN] + TX、ワルファリン(851)および亜鉛ホスフィド(640) + TXから構成される物質群から選択される殺鼠剤、

2-(2-プトキシエトキシ)-エチルピペロニレート(IUPAC名)(934) + TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903) + TX、ファルネソールを伴うネロリドール(代替名)(324) + TX、MB-599(開発コード)(498) + TX、MGK264(開発コード)(296) + TX、ピペロニルプトキシド(649) + TX、ピプロタール(1343) + TX、プロピル異性体(1358) + TX、S421(開発コード)(724) + TX、セサメックス(1393) + TX、セサスモリン(1394)およびスル

ホキシド(1406) + TX から構成される物質群から選択される共力剤、

アントラキノ(32) + TX、クロラロース(127) + TX、ナフテン酸銅 [CCN] + TX、オキシ塩化銅(171) + TX、ダイアジノン(227) + TX、ジシクロペンタジエン(化学名)(1069) + TX、グアザチン(422) + TX、グアザチン酢酸塩(422) + TX、メチオカルブ(530) + TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23) + TX、チラム(804) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、ナフテン酸亜鉛 [CCN] およびジラム(856) + TX から構成される物質群から選択される動物忌避剤、

イマニン(代替名) [CCN] およびリパピリン(代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される抗ウイルス剤、

酸化水銀(II)(512) + TX、オクチリノン(590) およびチオフアネートメチル(802) + TX から構成される物質群から選択される創傷保護剤、

ならびに、アメトクトラジン [865318-97-4] + TX、アミスルプロム [348635-87-0] + TX、アザコナゾール [60207-31-0] + TX、ベンゾピンジフルピル [1072957-71-1] + TX、ピテルタノール [70585-36-3] + TX、ピキサフェン [581809-46-3] + TX、プロムコナゾール [116255-48-2] + TX、クモキシストロピン [850881-70-8] + TX、シプロコナゾール [94361-06-5] + TX、ジフェノコナゾール [119446-68-3] + TX、ジニコナゾール [83657-24-3] + TX、エノキサストロピン [238410-11-2] + TX、エボキシコナゾール [106325-08-0] + TX、フェンブコナゾール [114369-43-6] + TX、フェンピラザミン [473798-59-3] + TX、フルキンコナゾール [136426-54-5] + TX、フルシラゾール [85509-19-9] + TX、フルトリアホール [76674-21-0] + TX、フルキサピロキサド [907204-31-3] + TX、フルオピラム [658066-35-4] + TX、フェナミンストロピン [366815-39-6] + TX、イソフェタミド [875915-78-9] + TX、ヘキサコナゾール [79983-71-4] + TX、イマザリル [35554-44-0] + TX、イミベンコナゾール [86598-92-7] + TX、イブコナゾール [125225-28-7] + TX、イブフェントリフルコナゾール [1417782-08-1] + TX、イソチアニル [224049-04-1] + TX、マンデストロピン [173662-97-0] (国際公開第2010/093059号に記載の手法に従って調製可能) + TX、メフェントリフルコナゾール [1417782-03-6] + TX、メトコナゾール [125116-23-6] + TX、ミクロブタニル [88671-89-0] + TX、パクロブトラゾール [76738-62-0] + TX、ペフラゾエート [101903-30-4] + TX、ペンフルフェン [494793-67-8] + TX、ペンコナゾール [66246-88-6] + TX、プロチオコナゾール [178928-70-6] + TX、ピリフェノックス [88283-41-4] + TX、プロクロラズ [67747-09-5] + TX、プロピコナゾール [60207-90-1] + TX、シメコナゾール [149508-90-7] + TX、テブコナゾール [107534-96-3] + TX、テトラコナゾール [112281-77-3] + TX、トリアジメホン [43121-43-3] + TX、トリアジメノール [55219-65-3] + TX、トリフルミゾール [99387-89-0] + TX、トリチコナゾール [131983-72-7] + TX、アンシミドール [12771-68-5] + TX、フェナリモル [60168-88-9] + TX、ヌアリモル [63284-71-9] + TX、ブピリメート [41483-43-6] + TX、ジメチリモール [5221-53-4] + TX、エチリモール [23947-60-6] + TX、ドデモルフ [1593-77-7] + TX、フェンプロピジン [67306-00-7] + TX、フェンプロピモルフ [67564-91-4] + TX、スピロキサミン [118134-30-8] + TX、トリデモルフ [81412-43-3] + TX、シプロジニル [121552-61-2] + TX、メパニピリム [110235-47-7] + TX、ピリメタニル [53112-28-0] + TX、フェンピクロニ

10

20

30

40

50

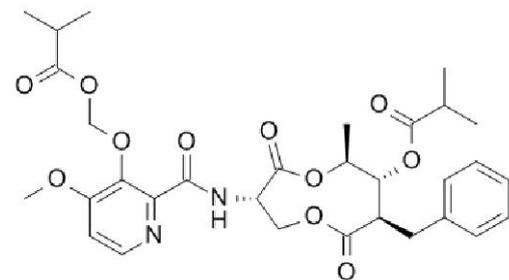
ル [ 7 4 7 3 8 - 1 7 - 3 ] + T X、フルジオキシニル [ 1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1 ] + T X、フルインダピル [ 1 3 8 3 8 0 9 - 8 7 - 7 ] + T X、ベナラキシル [ 7 1 6 2 6 - 1 1 - 4 ] + T X、フララキシル [ 5 7 6 4 6 - 3 0 - 7 ] + T X、メタラキシル [ 5 7 8 3 7 - 1 9 - 1 ] + T X、R - メタラキシル [ 7 0 6 3 0 - 1 7 - 0 ] + T X、オフレース [ 5 8 8 1 0 - 4 8 - 3 ] + T X、オキサジキシル [ 7 7 7 3 2 - 0 9 - 3 ] + T X、ベノミル [ 1 7 8 0 4 - 3 5 - 2 ] + T X、カルベンダジム [ 1 0 6 0 5 - 2 1 - 7 ] + T X、デバカルブ [ 6 2 7 3 2 - 9 1 - 6 ] + T X、フベリダゾール [ 3 8 7 8 - 1 9 - 1 ] + T X、チアベンダゾール [ 1 4 8 - 7 9 - 8 ] + T X、クロゾリネート [ 8 4 3 3 2 - 8 6 - 5 ] + T X、ジクロゾリン [ 2 4 2 0 1 - 5 8 - 9 ] + T X、イプロジオン [ 3 6 7 3 4 - 1 9 - 7 ] + T X、ミクロゾリン [ 5 4 8 6 4 - 6 1 - 8 ] + T X、プロシミドン [ 3 2 8 0 9 - 1 6 - 8 ] + T X、ピンクロゾリン [ 5 0 4 7 1 - 4 4 - 8 ] + T X、ボスカリド [ 1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6 ] + T X、カルボキシシン [ 5 2 3 4 - 6 8 - 4 ] + T X、フェンフラム [ 2 4 6 9 1 - 8 0 - 3 ] + T X、フルトラニル [ 6 6 3 3 2 - 9 6 - 5 ] + T X、フルチアニル [ 9 5 8 6 4 7 - 1 0 - 4 ] + T X、メプロニル [ 5 5 8 1 4 - 4 1 - 0 ] + T X、オキシカルボキシシン [ 5 2 5 9 - 8 8 - 1 ] + T X、ペンチオピラド [ 1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3 ] + T X、チフルザミド [ 1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7 ] + T X、グアザチン [ 1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6 ] + T X、ドジン [ 2 4 3 9 - 1 0 - 3 ] [ 1 1 2 - 6 5 - 2 ] ( 遊離塩基 ) + T X、イミノクタジン [ 1 3 5 1 6 - 2 7 - 3 ] + T X、アゾキシストロピン [ 1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8 ] + T X、ジモキシストロピン [ 1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4 ] + T X、エネストロプリン { Proc . B C P C , Int . C ongr . , G l a s g o w , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + T X、フルオキサストロピン [ 3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9 ] + T X、クレソキシム - メチル [ 1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0 ] + T X、メトミノストロピン [ 1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1 ] + T X、トリフロキシストロピン [ 1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7 ] + T X、オリザストロピン [ 2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0 ] + T X、ピコキシストロピン [ 1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5 ] + T X、ピラクロストロピン [ 1 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0 ] + T X、ピラオキシストロピン [ 8 6 2 5 8 8 - 1 1 - 2 ] + T X、フェルバム [ 1 4 4 8 4 - 6 4 - 1 ] + T X、マンコゼブ [ 8 0 1 8 - 0 1 - 7 ] + T X、マンネブ [ 1 2 4 2 7 - 3 8 - 2 ] + T X、メチラム [ 9 0 0 6 - 4 2 - 2 ] + T X、プロピネブ [ 1 2 0 7 1 - 8 3 - 9 ] + T X、チラム [ 1 3 7 - 2 6 - 8 ] + T X、ジネブ [ 1 2 1 2 2 - 6 7 - 7 ] + T X、ジラム [ 1 3 7 - 3 0 - 4 ] + T X、カプタホール [ 2 4 2 5 - 0 6 - 1 ] + T X、キャプタン [ 1 3 3 - 0 6 - 2 ] + T X、ジクロフルアニド [ 1 0 8 5 - 9 8 - 9 ] + T X、フルオロイミド [ 4 1 2 0 5 - 2 1 - 4 ] + T X、ホルベット [ 1 3 3 - 0 7 - 3 ] + T X、トリルフルアニド [ 7 3 1 - 2 7 - 1 ] + T X、ボルドー液 [ 8 0 1 1 - 6 3 - 0 ] + T X、水酸化銅 [ 2 0 4 2 7 - 5 9 - 2 ] + T X、塩化銅 [ 1 3 3 2 - 4 0 - 7 ] + T X、硫酸銅 [ 7 7 5 8 - 9 8 - 7 ] + T X、酸化銅 ( I I ) [ 1 3 1 7 - 3 9 - 1 ] + T X、マンカップー [ 5 3 9 8 8 - 9 3 - 5 ] + T X、オキシシン銅 [ 1 0 3 8 0 - 2 8 - 6 ] + T X、ジノカップ [ 1 3 1 - 7 2 - 6 ] + T X、ニトロタルイソプロピル [ 1 0 5 5 2 - 7 4 - 6 ] + T X、エディフェンホス [ 1 7 1 0 9 - 4 9 - 8 ] + T X、イプロベンホス [ 2 6 0 8 7 - 4 7 - 8 ] + T X、イソプロチオラン [ 5 0 5 1 2 - 3 5 - 1 ] + T X、ホスジフェン [ 3 6 5 1 9 - 0 0 - 3 ] + T X、ピラゾホス [ 1 3 4 5 7 - 1 8 - 6 ] + T X、トルコホス - メチル [ 5 7 0 1 8 - 0 4 - 9 ] + T X、アシベンゾラル - S - メチル [ 1 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2 ] + T X、アニラジン [ 1 0 1 - 0 5 - 3 ] + T X、ベンチアパリカルブ [ 4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7 ] + T X、プラストサイジン - S [ 2 0 7 9 - 0 0 - 7 ] + T X、キノメチオネート [ 2 4 3 9 - 0 1 - 2 ] + T X、クロロネブ [ 2 6 7 5 - 7 7 - 6 ] + T X、クロロタロニル [ 1 8 9 7 - 4 5 - 6 ] + T X、シフルフェナミド [ 1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3 ] + T X、シモキサニル [ 5 7 9 6 6 - 9 5 - 7 ] + T X、ジクロン [ 1 1 7 - 8 0 - 6 ] + T X、ジクロシメット [ 1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4 ] + T X、ジクロメジン [ 6 2 8 6 5 - 3 6 - 5 ] + T X、ジクロラン [ 9 9 - 3 0 - 9 ] + T X、ジエトフェンカルブ [ 8 7 1 3 0 - 2 0 - 9 ] + T X、ジメトモルフ [ 1 1 0 4 8 8 - 7 0 - 5 ] + T X、S Y P - L I 9 0 ( フル

モルフ) [ 2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9 ] + T X、ジチアノン [ 3 3 4 7 - 2 2 - 6 ] + T X  
 、エタボキサム [ 1 6 2 6 5 0 - 7 7 - 3 ] + T X、エトリジアゾール [ 2 5 9 3 - 1 5  
 - 9 ] + T X、ファモキサドン [ 1 3 1 8 0 7 - 5 7 - 3 ] + T X、フェンアミドン [ 1  
 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7 ] + T X、フェノキサニル [ 1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7 ] + T X、フ  
 エンチン [ 6 6 8 - 3 4 - 8 ] + T X、フェリムゾン [ 8 9 2 6 9 - 6 4 - 7 ] + T X、  
 フルアジナム [ 7 9 6 2 2 - 5 9 - 6 ] + T X、フルオピコリド [ 2 3 9 1 1 0 - 1 5 -  
 7 ] + T X、フルスルファミド [ 1 0 6 9 1 7 - 5 2 - 6 ] + T X、フェンヘキサミド [  
 1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8 ] + T X、ホセチル - アルミニウム [ 3 9 1 4 8 - 2 4 - 8 ] +  
 T X、ヒメキサゾール [ 1 0 0 0 4 - 4 4 - 1 ] + T X、イプロバリカルブ [ 1 4 0 9 2  
 3 - 1 7 - 7 ] + T X、I K F - 9 1 6 ( シアゾファミド ) [ 1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3 ] 10  
 + T X、カスガマイシン [ 6 9 8 0 - 1 8 - 3 ] + T X、メタスルホカルブ [ 6 6 9 5 2  
 - 4 9 - 6 ] + T X、メトラフェノン [ 2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6 ] + T X、ペンシクロン  
 [ 6 6 0 6 3 - 0 5 - 6 ] + T X、フタリド [ 2 7 3 5 5 - 2 2 - 2 ] + T X、ピカルブ  
 トラゾクス [ 5 0 0 2 0 7 - 0 4 - 5 ] + T X、ポリオキシシ [ 1 1 1 1 3 - 8 0 - 7 ]  
 + T X、プロベナゾール [ 2 7 6 0 5 - 7 6 - 1 ] + T X、プロバモカルブ [ 2 5 6 0 6  
 - 4 1 - 1 ] + T X、プロキナジド [ 1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4 ] + T X、ピジフルメトフ  
 エン [ 1 2 2 8 2 8 4 - 6 4 - 7 ] + T X、ピラメトストロピン [ 9 1 5 4 1 0 - 7 0 -  
 7 ] + T X、ピロキロン [ 5 7 3 6 9 - 3 2 - 1 ] + T X、ピリオフェノン [ 6 8 8 0 4  
 6 - 6 1 - 9 ] + T X、ピリベンカルブ [ 7 9 9 2 4 7 - 5 2 - 2 ] + T X、ピリゾキサ  
 ザール [ 8 4 7 7 4 9 - 3 7 - 5 ] + T X、キノキシフェン [ 1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7 ] 20  
 + T X、キントゼン [ 8 2 - 6 8 - 8 ] + T X、硫黄 [ 7 7 0 4 - 3 4 - 9 ] + T X、T  
 i m o r e x G o l d ( 商 標 ) ( S t o c k t o n G r o u p 製 の テ ィ ー ツ リ ー オ イ ル  
 を 含 む 植 物 抽 出 物 ) + T X、テブフロキン [ 3 7 6 6 4 5 - 7 8 - 2 ] + T X、チアジ  
 ニル [ 2 2 3 5 8 0 - 5 1 - 6 ] + T X、トリアゾキシド [ 7 2 4 5 9 - 5 8 - 6 ] + T  
 X、トルプロカルブ [ 9 1 1 4 9 9 - 6 2 - 2 ] + T X、トリクロピリカルブ [ 9 0 2 7  
 6 0 - 4 0 - 1 ] + T X、トリシクラゾール [ 4 1 8 1 4 - 7 8 - 2 ] + T X、トリホリ  
 ン [ 2 6 6 4 4 - 4 6 - 2 ] + T X、バリダマイシン [ 3 7 2 4 8 - 4 7 - 8 ] + T X、  
 バリフェナレート [ 2 8 3 1 5 9 - 9 0 - 0 ] + T X、ゾキサミド ( R H 7 2 8 1 ) [ 1  
 5 6 0 5 2 - 6 8 - 5 ] + T X、マンジプロバミド [ 3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2 ] + T X、  
 イソピラザム [ 8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1 ] + T X、フェナマクリル + T X、セダキサ [ 30  
 8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6 ] + T X、トリネキサバック - エチル [ 9 5 2 6 6 - 4 0 - 3 ]  
 + T X、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ( 9 -  
 ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン - 5 -  
 イル ) - アミド ( 国際公開第 2 0 0 7 / 0 4 8 5 5 6 号 に 開 示 さ れ て い る ) + T X、3 -  
 ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ( 3 ' , 4 ' , 5 '  
 - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル ) - アミド ( 国際公開第 2 0 0 6 / 0 8 7 3 4 3  
 号 に 開 示 さ れ て い る ) + T X、 [ ( 3 S , 4 R , 4 a R , 6 S , 6 a S , 1 2 R , 1 2 a  
 S , 1 2 b S ) - 3 - [ ( シ ク ロ プ ロ ピ ル カ ル ボ ニ ル ) オ キ シ ] - 1 , 3 , 4 , 4 a , 5  
 , 6 , 6 a , 1 2 , 1 2 a , 1 2 b - デ カ ヒ ド ロ - 6 , 1 2 - ジ ヒ ド ロ キ シ - 4 , 6 a ,  
 1 2 b - ト リ メ チ ル - 1 1 - オ キ ソ - 9 - ( 3 - ピ リ ジ ニ ル ) - 2 H , 1 1 H ナ フ ト [ 2  
 , 1 - b ] ピ ラ ノ [ 3 , 4 - e ] ピ ラ ン - 4 - イ ル ] メ チ ル - シ ク ロ プ ロ パ ン カ ル ボ キ シ  
 レ ー ト [ 9 1 5 9 7 2 - 1 7 - 7 ] + T X お よ び 1 , 3 , 5 - ト リ メ チ ル - N - ( 2 - メ  
 チ ル - 1 - オ キ ソ プ ロ ピ ル ) - N - [ 3 - ( 2 - メ チ ル プ ロ ピ ル ) - 4 - [ 2 , 2 , 2 -  
 ト リ フ ル オ ロ - 1 - メ ト キ シ - 1 - ( ト リ フ ル オ ロ メ チ ル ) エ チ ル ] フェ ニ ル ] - 1 H -  
 ピ ラ ザ ー ル - 4 - カ ル ボ キ サ ミ ド [ 9 2 6 9 1 4 - 5 5 - 8 ] + T X から なる 群 から 選 択  
 される 生物学的 に 有効 な 化合物、  
 または、N - [ ( 5 - ク ロ ロ - 2 - イ ソ プ ロ ピ ル - フェ ニ ル ) メ チ ル ] - N - シ ク ロ プ  
 ロ ピ ル - 3 - ( ジ フ ル オ ロ メ チ ル ) - 5 - フ ル オ ロ - 1 - メ チ ル - ピ ラ ザ ー ル - 4 - カ ル  
 ボ キ サ ミ ド ( 国際公開第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号 に 記 載 の 手 法 に 従 っ て 調 製 可 能 ) + T  
 X、2 , 6 - ジ メ チ ル - 1 H , 5 H - [ 1 , 4 ] ジ チ イ ノ [ 2 , 3 - c : 5 , 6 - c ' ] 40

ジピロール - 1, 3, 5, 7 (2H, 6H) - テトロン (国際公開第 2011/138281号に記載の手法に従って調製可能) + TX、6 - エチル - 5, 7 - ジオキソ - ピロロ [4, 5] [1, 4] ジチイノ [1, 2 - c] イソチアゾール - 3 - カルボニトリル + TX、4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロ - フェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - フェニル) - 2, 5 - ジメチル - ピラゾール - 3 - アミン (国際公開第 2012/031061号に記載の手法に従って調製可能) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2012/084812号に記載の手法に従って調製可能) + TX、CAS 850881 - 30 - 0 + TX、3 - (3, 4 - ジクロロ - 1, 2 - チアゾール - 5 - イルメトキシ) - 1, 2 - ベンゾチアゾール 1, 1 - ジオキシド (国際公開第 2007/129454号に記載の手法に従って調製可能) + TX、2 - [2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル] - 2 - メトキシ - N - メチル - アセトアミド + TX、3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 4 - ジヒドロ - 3, 3 - ジメチルイソキノリン - 1 - イル)キノロン (国際公開第 2005/070917号に記載の手法に従って調製可能) + TX、2 - [2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル)オキシ]フェニル]プロパン - 2 - オール (国際公開第 2011/081174号に記載の手法に従って調製可能) + TX、2 - [2 - [(7, 8 - ジフルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル)オキシ] - 6 - フルオロ - フェニル]プロパン - 2 - オール (国際公開第 2011/081174号に記載の手法に従って調製可能) + TX、オキサチアピプロリン + TX [1003318 - 67 - 9]、t - ブチル N - [6 - [[[(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン]アミノ]オキシメチル] - 2 - ピリジル]カルバメート + TX、N - [2 - (3, 4 - ジフルオロフェニル)フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル)ピラジン - 2 - カルボキサミド (国際公開第 2007/072999号に記載の手法に従って調製可能) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル]ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2014/013842号に記載の手法に従って調製可能) + TX、2, 2, 2 - トリフルオロエチル N - [2 - メチル - 1 - [[(4 - メチルベンゾイル)アミノ]メチル]プロピル]カルバメート + TX、(2RS) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - , - トリフルオロ - o - トリル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オール + TX、(2RS) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - , - トリフルオロ - o - トリル] - 3 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4, 5 - ジクロロチアゾール - 2 - イル)オキシ - 2, 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン (国際公開第 2007/031513号に記載の手法に従って調製可能) + TX、[2 - [3 - [2 - [1 - [2 - [3, 5 - ビス(ジフルオロメチル)ピラゾール - 1 - イル]アセチル] - 4 - ピペリジル]チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロイソキサゾール - 5 - イル] - 3 - クロロ - フェニル]メタンスルホン酸 (国際公開第 2012/025557号に記載の手法に従って調製可能) + TX、ブタ - 3 - イニル N - [6 - [[(Z) - [(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン]アミノ]オキシメチル] - 2 - ピリジル]カルバメート (国際公開第 2010/000841号に記載の手法に従って調製可能) + TX、2 - [[3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル] - 4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン (国際公開第 2010/146031号に記載の手法に従って調製可能) + TX、メチル N - [[5 - [4 - (2, 4 - ジメチルフェニル)トリアゾール - 2 - イル] - 2 - メチル - フェニル]メチル]カルバメート + TX、3 - クロロ - 6 - メチル - 5 - フェニル

- 4 - ( 2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル ) ピリダジン ( 国際公開第 2 0 0 5 / 1 2 1 1 0 4 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 2 - [ 2 - クロロ - 4 - ( 4 - クロロフェノキシ ) フェニル ] - 1 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパン - 2 - オール ( 国際公開第 2 0 1 3 / 0 2 4 0 8 2 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 3 - クロロ - 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン ( 国際公開第 2 0 1 2 / 0 2 0 7 7 4 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン - 3 - カルボニトリル ( 国際公開第 2 0 1 2 / 0 2 0 7 7 4 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 ( R ) - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - [ 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル ] ピラゾール - 4 - カルボキサミド ( 国際公開第 2 0 1 1 / 1 6 2 3 9 7 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル ) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド ( 国際公開第 2 0 1 2 / 0 8 4 8 1 2 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 1 - [ 2 - [ [ 1 - ( 4 - クロロフェニル ) ピラゾール - 3 - イル ] オキシメチル ] - 3 - メチル - フェニル ] - 4 - メチル - テトラゾール - 5 - オン ( 国際公開第 2 0 1 3 / 1 6 2 0 7 2 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 1 - メチル - 4 - [ 3 - メチル - 2 - [ [ 2 - メチル - 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリメチルピラゾール - 1 - イル ) フェノキシ ] メチル ] フェニル ] テトラゾール - 5 - オン ( 国際公開第 2 0 1 4 / 0 5 1 1 6 5 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 ( Z , 2 E ) - 5 - [ 1 - ( 4 - クロロフェニル ) ピラゾール - 3 - イル ] オキシ - 2 - メトキシイミノ - N , 3 - ジメチル - ペンタ - 3 - エンアミド + T X、 ( 4 - フェノキシフェニル ) メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + T X、 N - ( 5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル ) - N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [ 1 2 5 5 7 3 4 - 2 8 - 1 ] ( 国際公開第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号に記載の手法に従って調製可能 ) + T X、 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - [ ( R ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [ 1 3 5 2 9 9 4 - 6 7 - 2 ] + T X、 N ' - ( 2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル ) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X、 N ' - [ 4 - ( 4 , 5 - ジクロロ - チアゾール - 2 - イルオキシ ) - 2 , 5 - ジメチル - フェニル ] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X、 N ' - ( 2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル ) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X、 N ' - [ 4 - ( 4 , 5 - ジクロロ - チアゾール - 2 - イルオキシ ) - 2 , 5 - ジメチル - フェニル ] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X、

【化 1 5】



( フェンピコキサミド [ 5 1 7 8 7 5 - 3 4 - 2 ] ) + T X ( 国際公開第 2 0 0 3 / 0 3 5 6 1 7 号に記載のとおり )、 2 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、 2 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、 2 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 1 , 1 - ジメチル - 3 - プロピル - インダン - 4 - イル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、 2 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 3 - イソブチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、 2 - ( ジフルオロメチル ) - N - [ ( 3 R ) - 1 , 1 , 3 - トリメチ

ルインダン - 4 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX および 2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 1, 1 - ジメチル - 3 - プロピル - インダン - 4 - イル]ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX (ここで、これらのカルボキサミド化合物の各々は、国際公開第2014/095675号および/または国際公開第2016/139189号に記載の手法に従って調製可能である) からなる群から選択される生物学的に有効な化合物。

【0177】

例えば [3878 - 19 - 1] といった有効成分に続く括弧中の参照は、Chemical Abstracts Registry number を指している。上記の混合相手は公知である。有効成分が「The Pesticide Manual」[The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council] 中に含まれている場合、これらは、特定の化合物について本明細書中上記の丸括弧中に示されている項目番号下でその中に記載されており; 例えば、化合物「アバメクチン」は、項目番号(1)下に記載されている。上記に記載の特定の化合物について「[CCN]」が付記されている場合、対象の化合物は[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright (著作権) 1995 - 2004]にてインターネットを介してアクセス可能である「Compendium of Pesticide Common Names」に含まれており; 例えば、化合物「アセトプロール」は、インターネットアドレス <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> において記載されている。

【0178】

上記明細書において、上記の活性処方成分の大部分は、いわゆる「慣用名」、関連する「ISO 慣用名」または他の「慣用名」を個々の事例において用いることにより言及されている。「慣用名」による呼称ではない場合、代わりに用いられる呼称の性質は特定の化合物について丸括弧中に記載されており; この場合、IUPAC 名、IUPAC/Chemical Abstracts 名、「化学名」、「慣習名」、「化合物名」もしくは「開発コード」が用いられており、または、これらの呼称もしくは「慣用名」のいずれも用いられていない場合には、「代替名」が採用されている。「CAS 登録番号」は Chemical Abstracts Registry number を意味する。

【0179】

表 T1 (以下) に記載の化合物 1.1 ~ 1.43、または表 T2 (以下) に記載の化合物 2.1 ~ 2.30 から選択される式 (I) または (IA) の化合物、あるいは表 1.1A ~ 1.4A または 1.1B ~ 1.4B (以下) に記載の式 (I) または (IA) の化合物と、上記に記載されている活性処方成分との活性処方成分混合物は、好ましくは、100:1 ~ 1:6000、特に 50:1 ~ 1:50 の混合比であり、特に 20:1 ~ 1:20、特に 10:1 ~ 1:10、特に 5:1 および 1:5 の比であり、2:1 ~ 1:2 の比が特別に好ましく、ならびに、4:1 ~ 2:1 の比が同様に好ましく、とりわけ、1:1、または、5:1、または、5:2、または、5:3、または、5:4、または、4:1、または、4:2、または、4:3、または、3:1、または、3:2、または、2:1、または、1:5、または、2:5、または、3:5、または、4:5、または、1:4、または、2:4、または、3:4、または、1:3、または、2:3、または、1:2、または、1:600、または、1:300、または、1:150、または、1:35、または、2:35、または、4:35、または、1:75、または、2:75、または、4:75、または、1:6000、または、1:3000、または、1:1500、または、1:350、または、2:350、または、4:350、または、1:750、または、2:750、または、4:750 の比が好ましい。これらの混合比は重量基準である。

。

10

20

30

40

50

## 【0180】

上記の混合物は、上記の混合物を含む組成物を有害生物もしくはその環境に適用するステップを含む有害生物を防除する方法において用いられることが可能であるが、手術もしくは治療によるヒトもしくは動物の身体の処置法、および、ヒトまたは動物の身体において実施される診断法は除かれる。

## 【0181】

表1.1A~1.4Aもしくは1.1B~1.4B(以下)、または表T1もしくはT2(以下)の1つから選択される式(I)または(IA)の化合物と、上記に記載されている1種以上の活性処方成分とを含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」の形態で、単一の活性処方成分コンポーネントの個々の配合物から組成される「タンク混合物」などの複合型噴霧混合物で、および、逐次的(すなわち、数時間または数日間などの適度に短時間のうちに次々と)に適用される場合には単一の活性処方成分を併用して適用されることが可能である。表1.1~1.1A~1.4Aもしくは1.1B~1.4B(以下)、または表T1もしくはT2(以下)から選択される式(I)または(IA)の化合物と、上記に記載の活性処方成分とを適用する順番は、本発明の作用については重要ではない。

10

## 【0182】

本発明に係る組成物はまた、例えば無エポキシ化もしくはエポキシ化植物油(例えばエポキシ化ココナツ油、ナタネ油または大豆油)といった安定剤、例えばシリコン油といった消泡剤、防腐剤、粘度調整剤、バインダおよび/もしくは粘着剤、肥料、または、例えば殺菌剤、殺菌・殺カビ剤、抗線虫薬、植物活性化剤、殺軟体動物剤もしくは除草剤といった特定の効果を達成するための他の活性処方成分などのさらなる固体もしくは液体助剤を含んでいることが可能である。

20

## 【0183】

本発明に係る組成物は、それ自体は公知である様式において、助剤の不在下で、例えば、活性処方成分を粉末化し、スクリーニングし、および/または、固体に圧縮することにより調製され、ならびに、少なくとも1種の助剤の存在下に、例えば活性処方成分を助剤と共に均質混合し、および/または、粉末化することにより調製される。これらの組成物の調製プロセスおよびこれらの組成物の調製に係る化合物(I)または(IA)の使用もまた本発明の主題である。

## 【0184】

本発明の他の態様は、式(I)もしくは(IA)の化合物または本明細書に定義されている好ましい個別の化合物、少なくとも1種の式(I)もしくは(IA)の化合物または少なくとも1種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む組成物、または、少なくとも1種の式(I)もしくは(IA)の化合物または少なくとも1種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む殺菌・殺カビもしくは殺虫性混合物であって、上記の他の殺菌・殺カビ剤もしくは殺虫剤を伴う混和物における使用であり、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、または、昆虫もしくは好ましくは真菌性生物といった植物病原性微生物による非生体材料に係る外寄生を防除もしくは予防するための使用に関する。

30

40

## 【0185】

本発明のさらなる態様は、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、または、昆虫、もしくは、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による非生体材料に係る外寄生を防除もしくは予防する方法に関し、この方法は、式(I)もしくは(IA)の化合物または上記に定義されている好ましい個別の化合物を、活性処方成分として植物、植物の一部もしくはその生息地、その繁殖体、または、非生体材料のいずれかの部分に適用するステップを含む。

## 【0186】

防除もしくは予防とは、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在

50

的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による外寄生を、向上が実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【0187】

特に真菌性生物といった植物病原性微生物または昆虫による作物植物の外寄生を防除もしくは予防する好ましい方法であって、式(I)もしくは(I A)の化合物または前記化合物の少なくとも1種を含有する農芸化学組成物の適用を含む方法は、葉面処理である。適用頻度および適用量は、対応する病原体または昆虫による外寄生のリスクに応じることとなる。しかしながら、式(I)および(I A)の化合物はまた、植物の生息地に液体配合物を灌注することにより、または、例えば粒状形態(土壌施用)の固体形態で化合物を土壌に適用することにより、土壌(浸透移行作用)を介して根から植物に浸透させることが可能である。水稻作物の場合、このような粒質物を湛水した水田に適用することが可能である。式(I)または(I A)の化合物はまた、種子または塊茎を殺菌・殺カビ剤の液体配合物に含浸させることにより、または、これらを固体配合物でコーティングすることにより、種子に適用(コーティング)され得る。

10

【0188】

例えば、式(I)または(I A)の化合物と、所望の場合に、式(I)または(I A)の化合物をカプセル化する固体または液体補助剤またはモノマーとを含有する組成物といった配合物は、公知の様式で、典型的には、化合物を例えば溶剤、固体キャリアおよび任意選択により表面活性化合物(界面活性剤)といった増量剤と一緒に均質に混合し、および/または、粉碎することにより調製され得る。

20

【0189】

有利な適用量は、通常、1ヘクタール(ha)当たり、5g~2kgの活性処方成分(a.i.)、好ましくは10g~1kg a.i./ha、最も好ましくは20g~600g a.i./haである。種子灌注剤として用いられる場合、簡便な投与量は、1kgの種子に対して10mg~1gの活性物質である。

【0190】

本発明の組み合わせが種子の処理に用いられる場合、1kgの種子に対して0.001~50gの式Iの化合物、好ましくは、1kgの種子に対して0.01~10gの量が一般に十分とされる。

【0191】

好適には、本発明に係る式(I)または(I A)の化合物を含む組成物は、病害の発生前を意味する予防的に、または、病害の発生後を意味する治療的に適用される。

30

【0192】

本発明の組成物は、いずれかの従来形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末(DS)、種子処理用エマルジョン(ES)、種子処理用流動性濃縮物(FS)、種子処理用溶液(LS)、種子処理用水分散性粉末(WS)、種子処理用カプセル懸濁液(CF)、種子処理用ゲル(GF)、エマルジョン濃縮物(EC)、懸濁液濃縮物(SC)、サスボエマルジョン(SE)、カプセル懸濁液(CS)、水分散性顆粒(WG)、乳化性顆粒(EG)、エマルジョン、油中水型(EO)、エマルジョン、水中油型(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油分散体(OD)、油混和性の流動体(OF)、混油性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、超低体積懸濁液(SU)、超低体積液体(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、または、農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物の形態で採用され得る。

40

【0193】

このような組成物は、従来様式で、例えば活性処方成分を、適切な不活性配合物(希釈剤、溶剤、充填材、ならびに、界面活性剤、殺生剤、不凍剤、展着剤、増粘剤およびアジュバント活性効果をもたらす化合物などの任意選択により他の配合成分)と混合することにより、生成され得る。また、従来緩効性配合物は、長期にわたって持続する効力が意図される場合に採用され得る。特に、水分散性濃縮物(例えばEC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等)、水和剤および顆粒などの吹付け形態で適用される配合物は、例

50

例えばホルムアルデヒドとナフタレンスルホン酸塩との縮合物、アルキルアリアルスルホネート、リグニンスルホン酸塩、脂肪アルキルスルフェート、およびエトキシ化アルキルフェノールおよびエトキシ化脂肪族アルコールといった、湿潤剤および分散剤およびアジュバント効果をもたらす他の化合物などの界面活性剤を含有していてもよい。

【0194】

種子粉衣配合物は種子にそれ自体公知である様式で適用され、例えば水性懸濁液または種子に良好な接着性を有する乾燥粉末形態といった好適な種子粉衣配合物形態で、本発明の組み合わせおよび希釈剤を利用する。このような種子粉衣配合物は技術分野において公知である。種子粉衣配合物は、単一種の活性処方成分を含有していても、または、例えば緩効性カプセルもしくはマイクロカプセルとしてカプセル化形態で活性処方成分の組み合わせを含有していてもよい。

10

【0195】

普通、配合物は、0.01~90重量%の活性薬剤、0~20%の農学的に許容可能な界面活性剤、ならびに、10~99.99%の固体または液体不活性配合物および補助剤を含み、活性薬剤は、少なくとも式(I)の化合物を、任意選択により他の活性薬剤、特に殺菌剤または防腐剤等を一緒に伴って構成されている。組成物の濃縮形態は、一般に、約2~80%、好ましくは約5~70重量%の活性薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば0.01~20重量%、好ましくは0.01~5重量%の活性薬剤を含有し得る。市販製品は濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは通常希釈した配合物を利用することとなる。

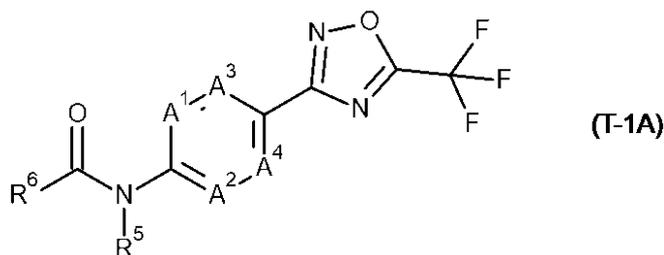
20

【0196】

市販の製品を濃縮物として配合することが好ましいが、エンドユーザーは通常配合物を希釈して使用するであろう。

【0197】

表1.1A: この表は、94種の特定の式(T-1A)の化合物を開示するものであり、  
【化16】



30

式中、A<sup>1</sup>~A<sup>4</sup>は、それぞれ独立して、C-Hであり、R<sup>5</sup>は、水素であり、R<sup>6</sup>は、表1Aにおいて下記で定義した通りである。

【0198】

表1.2A~1.4Aのそれぞれ(表1.1Aに続く)は、94種の個々の式(T-1A)の化合物を提供するものであり、式中、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、R<sup>6</sup>が特に定義されている表1Aを参照する表1.2A~1.4Aにおいて特に定義されている通りである。

40

【0199】

【表 1 - 1】

表 1A

化合物 番号	R <sup>6</sup>	化合物 番号	R <sup>6</sup>
1A.001	(1,2,4-トリアゾール-1-イル)メチル	1A.048	2-フェニルエチル
1A.002	(2-フルオロフェニル)メチル	1A.049	3,3,3-トリフルオロプロピル
1A.003	(2-メトキシエトキシ)メチル	1A.050	3,4,5-トリメトキシフェニル
1A.004	(2-オキソ-2-エチルアセテート)メチル	1A.051	3,4-ジメトキシフェニル
1A.005	(2-チエニル)メチル	1A.052	3-メトキシ-5-オキソシクロヘキ セン-3-イル
1A.006	(3,3-ジフルオロシクロブチル)メチル	1A.053	3-メトキシプロピル
1A.007	(3,4,5-トリメトキシフェニル)エチル	1A.054	3-メチルブチル
1A.008	(3,5-ジクロロ-2-ピリジル)-1,1-ジメチ ル-メチル	1A.055	3-メチルオキセタン-3-イル
1A.009	(3,5-ジフルオロフェニル)メチル	1A.056	3-オキソ-シクロブチル
1A.010	(3-ピリジル)エチル	1A.057	4,4,4-トリフルオロブチル
1A.011	(3-ピリジル)メチル	1A.058	4-イミダゾール-1-イル-フェニル
1A.012	(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)メ チル	1A.059	4-メトキシブチル
1A.013	(4-メトキシフェニル)メチル	1A.060	5,5-ジフルオロペンテン-4-イル
1A.014	(4-ピリジル)エチル	1A.061	6-モルホリノピラジン-2-イル
1A.015	(5-メチルピラゾール-1-イル)メチル	1A.062	ブテン-3-イル
1A.016	(E)-3,3,3-トリフルオロプロペン 2-イ ル	1A.063	シアノメチル
1A.017	(ピラゾール-1-イル)メチル	1A.064	シクロブチル
1A.018	[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メ チル	1A.065	シクロペンテン-3-イル
1A.019	[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル] メチル	1A.066	シクロペンテン-1-イル
1A.020	[4-[2-オキソ-2-アニリノ]エチル]フェ ニルメチル	1A.067	シクロペンチル
1A.021	[6-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル] メチル	1A.068	シクロプロピル
1A.022	[6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル] メチル	1A.069	シクロプロピルメチル
1A.023	1,3-ジオキソラン-2-イル	1A.070	ジフルオロメチル
1A.024	1-シアノシクロプロピル	1A.071	エトキシメチル
1A.025	1-フルオロシクロプロピル	1A.072	エチル
1A.026	1H-ピラゾール-4-イル	1A.073	イミダゾ[1,2-a]ピリジン-8-イル

10

20

30

40

【表 1 - 2】

1A.027	1-メトキシエチル	1A.074	イソブチル	
1A.028	1-メチルシクロプロピル	1A.075	イソプロポキシメチル	
1A.029	1-フェノキシエチル	1A.076	イソプロピル	
1A.030	2-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)フェニル	1A.077	メトキシメチル	
1A.031	2-(1-ピペリジル)エチル	1A.078	メチル	
1A.032	2-(メトキシメチル)-4-メチル-チアゾール-5-イル	1A.079	メトキシカルボニル-2,2-ジメチルエチル	10
1A.033	2-(メトキシメチル)ブチル	1A.080	メチルスルホニル-メチル	
1A.034	2-(トリフルオロメチル)フェニル	1A.081	N-(シクロプロピルメチル)-N-メトキシアミノ	
1A.035	2,2,2-トリフルオロエチル	1A.082	チエタン-3-イル	
1A.036	2,2-ジフルオロシクロプロピル	1A.083	ペンテン-4-イル	
1A.037	2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル	1A.084	ペンチル	
1A.038	2,2-ジメチルシクロプロピル	1A.085	ペンチン-4-イル	20
1A.039	N-tert-ブチルアミノカルボニルメチル	1A.086	フェニル	
1A.040	2-クロロフェニル	1A.087	フェニルフルオロメチル	
1A.041	2-エチルブチル	1A.088	フェニルスルファニルメチル	
1A.042	2-フルオロシクロプロピル	1A.089	プロピル	
1A.043	2-ヒドロキシエチル	1A.090	テトラヒドロフラン-2-イル	
1A.044	2-メトキシ-メチル	1A.091	テトラヒドロフラン-3-イル	
1A.045	2-メチルブチル	1A.092	テトラヒドロピラン-2-イル	
1A.046	2-メチルシクロプロピル	1A.093	テトラヒドロチオピラン-4-イル	30
1A.047	2-メチルペンチル	1A.094	トリフルオロメチル	

## 【0200】

表 1 . 2 A : この表は、94種の特定の式(T-1A)の化合物を開示するものであり、式中、A<sup>1</sup>は、C-Hであり、A<sup>2</sup>は、C-Hであり、A<sup>3</sup>は、C-Hであり、A<sup>4</sup>は、C-Hであり、R<sup>5</sup>は、メチルであり、R<sup>6</sup>は、表1Aにおいて上記で定義されている通りである。

## 【0201】

表 1 . 3 A : この表は、94種の特定の式(T-1A)の化合物を開示するものであり、式中、A<sup>1</sup>は、C-Hであり、A<sup>2</sup>は、C-Hであり、A<sup>3</sup>は、C-Hであり、A<sup>4</sup>は、C-Hであり、R<sup>5</sup>は、エチルであり、R<sup>6</sup>は、表1Aにおいて上記で定義されている通りである。

## 【0202】

表 1 . 4 A : この表は、94種の特定の式(T-1A)の化合物を開示するものであり、式中、A<sup>1</sup>は、C-Hであり、A<sup>2</sup>は、C-Hであり、A<sup>3</sup>は、C-Hであり、A<sup>4</sup>は、C-Hであり、R<sup>5</sup>は、メトキシであり、R<sup>6</sup>は、表1Aにおいて上記で定義されている通りである。

## 【0203】

表 1 . 1 B : この表は、24種の特定の式(T-1B)の化合物を開示するものであり、

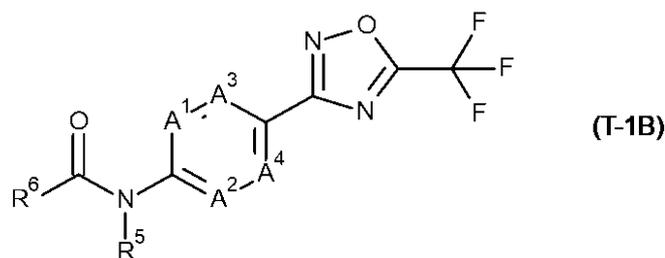
10

20

30

40

## 【化17】



式中、 $A^1$ - $A^4$ は、それぞれ独立して、C - Hであり、 $R^5$ は、水素であり、 $R^6$ は、表1Bにおいて下記で定義した通りである。 10

## 【0204】

表1.2B~1.4Bのそれぞれ(表1.1Bに続く)は、19種の個々の式(T-1B)の化合物を提供するものであり、式中、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^5$ 、および $R^6$ は、 $R^6$ が特に定義されている表1Bを参照する表1.2B~1.4Bに特に定義されている通りである。

## 【0205】

## 【表2】

表1B

化合物番号	$R^6$	化合物番号	$R^6$
1B.001	N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノ	1B.011	N-メトキシ-N-(2-メトキシエチル)アミノ
1B.002	N-(2-メチルアリルオキシ)アミノ	1B.012	N-メトキシ-N-エチル
1B.003	N-(3-メチルブタ-2-エノキシ)アミノ	1B.013	N-メチル-N-(2-メチルアリルオキシ)アミノ
1B.004	N-[(2-フルオロフェニル)メトキシ]アミノ	1B.014	N-ピロリジン-1-イル
1B.005	N-アリルオキシアミノ	1B.015	N-ピペラジン-1-イル
1B.006	N-アリルオキシ-N-メチルアミノ	1B.016	N-モルホリノ1-イル
1B.007	N-エチル-N-メトキシアミノ	1B.017	メトキシ
1B.008	N-メトキシアミノ	1B.018	エトキシ
1B.009	4-メトキシ-N-ピペラジン-1-イル	1B.019	イソプロポキシ
1B.010	N-オキサジナン-2-イル		

## 【0206】

表1.2B: この表は、19種の特定の式(T-1B)の化合物を開示するものであり、式中、 $A^1$ は、C - Hであり、 $A^2$ は、C - Hであり、 $A^3$ は、C - Hであり、 $A^4$ は、C - Hであり、 $R^5$ は、メチルであり、 $R^6$ は、表1Bにおいて上記で定義されている通りである。 40

## 【0207】

表1.3B: この表は、19種の特定の式(T-1B)の化合物を開示するものであり、式中、 $A^1$ は、C - Hであり、 $A^2$ は、C - Hであり、 $A^3$ は、C - Hであり、 $A^4$ は、C - Hであり、 $R^5$ は、エチルであり、 $R^6$ は、表1Bにおいて上記で定義されている通りである。

## 【0208】

表1.4B: この表は、19種の特定の式(T-1B)の化合物を開示するものであり、 50

式中、 $A^1$ は、C - Hであり、 $A^2$ は、C - Hであり、 $A^3$ は、C - Hであり、 $A^4$ は、C - Hであり、 $R^5$ は、メトキシであり、 $R^6$ は、表 1 Bにおいて上記で定義されている通りである。

【0209】

下記の一般手順を、適当な構造ブロック（化合物（II）および（III））を使用して組み合わせ様式で使用し、式（I）および（IA）の化合物を得た。下記の組み合わせプロトコルによって調製した化合物を、LC/MS方法Bを使用して分析した。

【実施例】

【0210】

以下の実施例は本発明を例示するものである。

10

【0211】

本発明の化合物は低施用量でのより高い効力により公知の化合物とは区別可能であり、これは、実施例において概説されている実験手法を用い、必要に応じて、例えば50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppmまたは0.2 ppmといったより少ない施用量を用いることで当業者によって検証が可能である。

【0212】

式（I）または（IA）の化合物は、とりわけ、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る有利なレベルの生物学的活性、または、農芸化学活性処方成分としての使用に係る優れた特性（例えば、高い生物学的活性、有利な活性スペクトル、高い安全性プロファイル（向上した作物耐性を含む）、向上した物理化学的特性、または、高い生分解性）を含む多数の有益性を有し得る。

20

【0213】

本記載を通じて、温度は摂氏度（ $^{\circ}\text{C}$ ）で示されており、「m.p.」は融点を意味する。LC/MSは液体クロマトグラフィ質量分析法を意味し、LC/MS分析のための装置および方法の説明は以下のとおりである。

【0214】

装置および方法Aの説明は以下のとおりである：

Waters製SQ Detector 2

イオン化方法：エレクトロスプレー

極性：陽イオンおよび陰イオン

キャピラリ（kV）3.0、コーン（V）30.00、抽出器（V）2.00、ソース温度（ $^{\circ}\text{C}$ ）150、脱溶剤温度（ $^{\circ}\text{C}$ ）350、コーンガス流（L/Hr）0、脱溶剤ガス流（L/Hr）650

30

質量範囲：100 ~ 900 Da

DAD波長範囲（nm）：210 ~ 500

【0215】

方法 以下のHPLC勾配条件を用いるWaters製ACQUITY UPLCによる：

（溶剤A：水/メタノール20：1 + 0.05%ギ酸および溶剤B：アセトニトリル + 0.05%ギ酸）

40

【0216】

【表3】

時間(分間)	A(%)	B(%)	流量(ml/min)
0	100	0	0.85
1.2	0	100	0.85
1.5	0	100	0.85

【0217】

カラムのタイプ：Waters製ACQUITY UPLC HSS T3；カラム長

50

： 30 mm ; カラムの内径 : 2.1 mm ; 粒径 : 1.8 ミクロン ; 温度 : 60 。

【 0 2 1 8 】

装置および方法 B の説明は以下のとおりである :

W a t e r s 製 S Q D e t e c t o r 2

イオン化方法 : エレクトロスプレー

極性 : 陽イオン

キャピラリ ( k V ) 3.5、コーン ( V ) 30.00、抽出器 ( V ) 3.00、ソース温度 ( ) 150、脱溶剤温度 ( ) 400、コーンガス流 ( L / H r ) 60、脱溶剤ガス流 ( L / H r ) 700

質量範囲 : 140 ~ 800 D a

D A D 波長範囲 ( n m ) : 210 ~ 400

【 0 2 1 9 】

方法 以下の H P L C 勾配条件を用いる W a t e r s 製 A C Q U I T Y U P L C による ( 溶剤 A : 水 / メタノール 9 : 1 + 0.1 % ギ酸および溶剤 B : アセトニトリル + 0.1 % ギ酸 )

【 0 2 2 0 】

【 表 4 】

時間(分間)	A(%)	B(%)	流量(ml/min)
0	100	0	0.75
2.5	0	100	0.75
2.8	0	100	0.75
3.0	100	0	0.75

【 0 2 2 1 】

カラムのタイプ : W a t e r s 製 A C Q U I T Y U P L C H S S T 3 ; カラム長 : 30 mm ; カラムの内径 : 2.1 mm ; 粒径 : 1.8 ミクロン ; 温度 : 60 。

【 0 2 2 2 】

必要に応じて、鏡像異性的に純粋な最終化合物が、適宜、逆相キラルクロマトグラフィなどの標準的な物理的分離技術によって、または例えば、キラル出発材料を用いることによる立体選択的合成技術によって、ラセミ材料から得られる。

【 0 2 2 3 】

配合物実施例

【 0 2 2 4 】

【 表 5 】

水和剤	a)	b)	c)
活性処方成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	-
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	-	5 %
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	-	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル	-	2 %	-
(7~8 mol のエチレンオキシド)			
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	-

【 0 2 2 5 】

活性処方成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉砕して、

水で希釈された所望の濃度の懸濁液をもたらすことが可能である水和剤を得た。

【0226】

【表6】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
活性処方成分[式(I)の化合物]	25%	50%	75%
軽質鉱油	5%	5%	5%
高分散ケイ酸	5%	5%	-
カオリン	65%	40%	-
タルカム	-		20%

10

【0227】

活性処方成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得た。

【0228】

乳化性濃縮物

活性処方成分[式(I)の化合物]	10%	
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル (4~5molのエチレンオキシド)	3%	
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3%	
ヒマシ油ポリグリコールエーテル(35molのエチレンオキシド)	4%	
シクロヘキサノン	30%	
キシレン混合物	50%	

20

【0229】

植物の保護において用いられることが可能である、任意の必要とされる希釈率のエマルジョンを、この濃縮物から水による希釈で得ることが可能である。

【0230】

【表7】

粉剤	a)	b)	c)
活性処方成分[式(I)の化合物]	5%	6%	4%
タルカム	95%	-	-
カオリン	-	94%	-
無機充填材	-	-	96%

30

【0231】

すぐに使用可能な粉剤は、活性処方成分とキャリアとを混合し、この混合物を好適なミルで粉砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣に用いられることも可能である。

40

【0232】

押し出し顆粒

活性処方成分[式(I)の化合物]	15%
リグノスルホン酸ナトリウム	2%
カルボキシメチルセルロース	1%
カオリン	82%

【0233】

活性処方成分を補助剤と混合および粉砕し、この混合物を水で湿らせる。この混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。

50

## 【 0 2 3 4 】

コーティングされた顆粒

活性処方成分 [ 式 ( I ) の化合物 ]        8 %  
 ポリエチレングリコール ( m o l . w t . 2 0 0 )        3 %  
 カオリン        8 9 %

## 【 0 2 3 5 】

細かく粉碎した活性処方成分を、ミキサ中において、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉末を発生しないコーティングされた顆粒がこのようにして得られる。

## 【 0 2 3 6 】

懸濁液濃縮物

活性処方成分 [ 式 ( I ) の化合物 ]        4 0 %  
 プロピレングリコール        1 0 %  
 ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル ( 1 5 m o l のエチレンオキシド ) 6 %  
 リグノスルホン酸ナトリウム        1 0 %  
 カルボキシメチルセルロース        1 %  
 シリコン油 ( 7 5 % 水中エマルジョンの形態 )        1 %  
 水        3 2 %

## 【 0 2 3 7 】

細かく粉碎した活性処方成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

## 【 0 2 3 8 】

種子処理に係る流動性濃縮物

活性処方成分 [ 式 ( I ) の化合物 ]        4 0 %  
 プロピレングリコール        5 %  
 コポリマーブタノール P O / E O        2 %  
 1 0 ~ 2 0 モルの E O を伴うトリスチレンフェノール        2 %  
 1 , 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン ( 2 0 % 水溶液の形態 )        0 . 5 %  
 モノアゾ - 顔料カルシウム塩        5 %  
 シリコン油 ( 7 5 % 水中エマルジョンの形態 )        0 . 2 %  
 水        4 5 . 3 %

## 【 0 2 3 9 】

細かく粉碎した活性処方成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

## 【 0 2 4 0 】

緩効性カプセル懸濁液

2 8 部の組み合わせた式 ( I ) の化合物を、2 部の芳香族溶剤および7 部のトルエンジイソシアネート / ポリメチレン - ポリフェニルイソシアネート混合物 ( 8 : 1 ) と混合する。この混合物を、1 . 2 部のポリビニルアルコール、0 . 0 5 部の脱泡剤および5 1 . 6 部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、5 . 3 部の水中の2 . 8 部の1 , 6 - ジアミノヘキサンの混合物を添加する。この混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。

## 【 0 2 4 1 】

得られるカプセル懸濁液を、0 . 2 5 部の増粘剤および3 部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、2 8 % の活性処方成分を含有する。中程度

10

20

30

40

50

のカプセル径は 8 ~ 15 ミクロンである。

【0242】

得られる配合物を、目的に好適な装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

【0243】

略語のリスト：

D I P E A = N , N - ジイソプロピルエチルアミン

D M A = ジメチルアセトアミド

E t O A c = 酢酸エチル

L C / M S = 液体クロマトグラフィ / 質量分析

m p = 融点

M e O H = メチルアルコール

N a O H = 水酸化ナトリウム

T F A A = トリフルオロ酢酸無水物

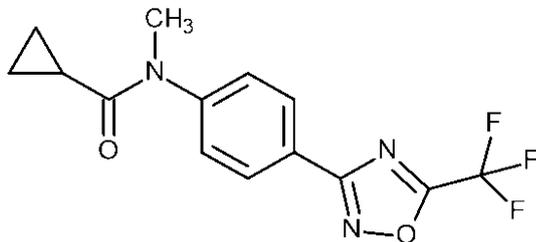
【0244】

調製の実施例

実施例 1

この実施例は、N - メチル - N - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] シクロプロパンカルボキサミド (表 T 1 の化合物 1 . 1 2 8 ) の調製を例示する。

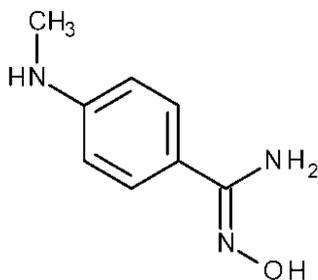
【化 1 8】



【0245】

ステップ 1 : 4 - N' - ヒドロキシ - 4 - (メチルアミノ) ベンズアミジンの調製

【化 1 9】



4 - メチルアミノベンゾニトリル ( 1 . 0 g 、 7 . 6 m m o l ) のエタノール ( 1 3 m L ) 溶液に、10 mL の水中のヒドロキシアミン塩酸塩溶液 ( 1 . 0 6 g 、 1 5 . 1 m m o l ) 、それに続いて 1 5 m L の水中の炭酸カリウム ( 1 . 6 7 g 、 1 2 . 1 m m o l ) を加えた。次いで、濁った溶液に、キノリン - 8 - オール ( 1 4 . 0 g 、 0 . 1 m m o l ) を導入した。反応混合物を 8 0 ° で一晩攪拌した。次いで、反応混合物を 2 5 ° に冷却し、エタノールを減圧下で除去し、次いで、このように得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、濃縮し、1 . 1 8 g の N' - ヒドロキシ - 4 - (メチルアミノ) ベンズアミジン黄色の固体として得た。粗残渣を、下記のステップにおいてそれ以上精製することなく使用した。L C / M S (方法 A) 保持時間 = 0 . 2 1 分 ; 1 6 6 [ M + H<sup>+</sup> ] 。

<sup>1</sup>H N M R ( 4 0 0 M H z 、 C D C l<sub>3</sub> ) p p m : 7 . 4 5 ( d 、 2 H ) 、 6 . 6 5 (

10

20

30

40

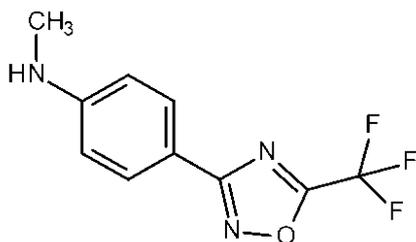
50

d、2 H)、5.85 (m、1 H)、5.60 (s、2 H)、2.75 (m、3 H)。

【0246】

ステップ2：N-メチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリンの調製

【化20】



10

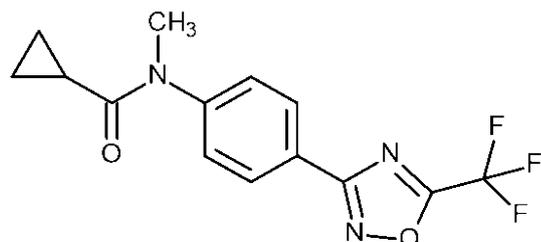
N'-ヒドロキシ-4-(メチルアミノ)ベンズアミジン(7.04 g、42.6 mmol)の2-メチルテトラヒドロフラン(128 mL)溶液に、TFAA(8.4 mL、60 mmol)を滴下の添加によって導入した。反応混合物を25℃で4時間攪拌し、次いで、水でゆっくりとクエンチし、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、濃縮し、次いで、シリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィ(シクロヘキサン：EtOAc溶離液の勾配、99：1から80：20)に供し、このように、1.64 gのN-メチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリンを黄色の油として得た。LC/MS(方法A)保持時間=1.10分；244[M+H<sup>+</sup>]

20

【0247】

ステップ3：N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミドの調製

【化21】



30

N-メチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリン(0.10 g、0.41 mmol)のジクロロメタン(6 mL)溶液に、トリエチルアミン(0.15 mL、1.07 mmol)およびシクロプロパンカルボニル(0.04 g、0.49 mmol)を導入し、反応混合物を25℃で1時間攪拌し、次いで、水およびジクロロメタンを加えた。水層をジクロロメタンで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、揮発性物質を減圧下で除去した。原油をシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィ(ヘプタン：EtOAc溶離液の勾配、99：1から80：20)によって精製し、0.076 gのN-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミドを得た。LC/MS(方法A)保持時間=1.08分、312(M+H)。

40

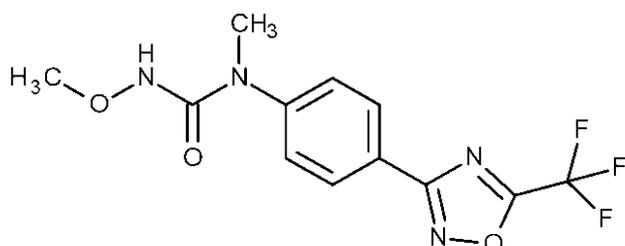
【0248】

実施例2

この実施例は、3-メトキシ-1-メチル-1-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素(表T1の化合物1.132)の調製を例示する。

50

## 【化22】



## 【0249】

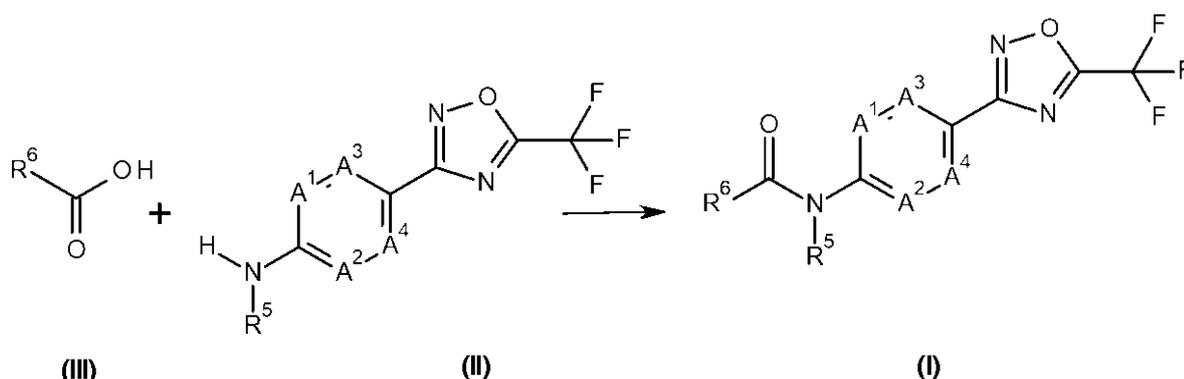
10

N-メチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリン(0.20g、0.822mmol)のTHF(6mL)溶液に、カルボニルジイミダゾール(0.54g、3.28mmol)、メトキシアミン塩酸塩(0.24g、2.96mmol)、およびジイソプロピルエチルアミン(0.50mL、2.96mmol)を導入した。反応混合物を55にて48時間撹拌した。内容物を25に冷却し、isoluteを加え、揮発性物質を減圧下で除去した。粗残渣を、シリカゲル(シクロヘキサン:EtOAc溶離液の勾配、99:1から80:20)上のフラッシュクロマトグラフィによって精製し、0.010gの3-メトキシ-1-メチル-1-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素を得た。LC/MS(方法A)保持時間=0.90分、317(M+H)。

20

$^1\text{H NMR}$ (400MHz、 $\text{CDCl}_3$ ) ppm: 8.13(d、2H)、7.35(d、2H)、7.05(brs、1H)、3.60(s、3H)、3.25(s、3H)。

## 【化23】



30

## 【0250】

例示のために、式(III)の酸誘導体(375 $\mu\text{l}$ のDMA中0.0375mmol)を、250 $\mu\text{l}$ のDMA中の式(II)の[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アリアル]メタンアミン誘導体(0.03mmol)およびDIPEA(0.09mmol)を含有する96スロットディーブウェルプレート(DWP96)に移し、それに続いて、DMA(250 $\mu\text{l}$ )に溶解したBOP-Cl(0.06mmol)を加えた。DWPを密封し、50で18時間撹拌した。溶媒を窒素流下で除去した。生成した粗残渣を、MeOH(250 $\mu\text{l}$ )およびDMA(500 $\mu\text{l}$ )の混合物に可溶化し、分取LC/MS精製に直接供し、それによって、式(I)の化合物を10~85%収率で得た。

40

## 【0251】

必要に応じて、鏡像異性的に純粋な最終化合物は、適宜、標準的な物理的分離技術、例えば、逆相キラルクロマトグラフィによって、または立体選択的合成技術(例えば、キラル出発材料を使用することによる)によって、ラセミ材料から得てもよい。

## 【0252】

【表 8 - 1】

表 T1:式(I)および(IA)による化合物についての融点(mp)データ及び/又は保持時間(R<sub>t</sub>):

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.1	2-(トリフルオロメチル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド					162-163
1.2	6-モルホリノ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ピラジン-2-カルボキサミド		1.7	421.3	B	
1.3	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド		1.73	334.22	B	
1.4	1,7,7-トリメチル-2-オキソ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]-3-オキサビシクロ[2.2.1]ヘプタン-4-カルボキサミド		1.86	410.3	B	
1.5	2,2-ジメチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタ-3-イナミド		1.78	324.23	B	

10

20

30

40

【表 8 - 2】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.6	3,4,5-トリメトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド		1.74	424.28	B	
1.7	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-8-カルボキサミド		1.63	373.8	B	
1.8	7-クロロ-1-シクロプロピル-6-フルオロ-4-オキソ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]キノリン-3-カルボキサミド		2.16	493.26	B	
1.9	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-5-カルボキサミド		1.82	392.24	B	
1.10	2-メチルスルホニル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.31	350.2	B	

10

20

30

40

【表 8 - 3】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.11	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド		1.32	324.2	B	200-204
1.12	2-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.68	392.24	B	
1.13	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]-3-(3,4,5-トリメトキシフェニル)プロパンアミド		1.71	452.33	B	
1.14	ベンジル N-[2-オキソ-1-フェニル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]エチル]カルバメート		1.91	497.35	B	
1.15	4-シアノ-2,6-ジフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド		1.73	395.21	B	

10

20

30

40

【表 8 - 4】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.16	2-フルオロ-2-フェニル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.76	366.22	B	
1.17	3-(1-ナフチル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパ-2-エナミド		2.02	410.27	B	
1.18	tert-ブチル N-[2-オキソ-1-フェニル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]エチル]カルバメート		1.91	463.34	B	
1.19	2-フルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.41	290.13	B	
1.20	4,4,4-トリフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンアミド		1.7	354.22	B	

10

20

30

40

【表 8 - 5】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.21	1-(ヘキサ-2,4-ジエノイルアミノ)-3-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロヘキサンカルボキサミド		1.96	463.39	B	
1.22	2-(4,6-ジメトキシピリジン-2-イル)オキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ピリジン-3-カルボキサミド		1.87	489.33	B	
1.23	2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.24	339.21	B	
1.24	2-(5-ブロモ-2-メトキシ-フェニル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.99	470.22	B	
1.25	4-クロロ-5-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.84	438.22	B	

10

20

30

40

【表 8 - 6】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.26	2-(4-アセトアミドフェニル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.44	405.34	B	
1.27	N-[4-[2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]エチル]フェニル]プロパンアミド		1.52	419.32	B	
1.28	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]チアジアゾロ[5,4-c]ピリジン-4-カルボキサミド		1.93	393.21	B	
1.29	3-フルオロ-N2-イソプロピル-N1-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]フタルアミド		1.61	437.31	B	
1.30	tert-ブチル N-[2-メチル-1-[5-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバモイル]-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]プロピル]カルバメート		1.86	498.40	B	

10

20

30

40

【表 8 - 7】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.31	3-メトキシ-5-オキソ -N-[4-[5-(トリフル オロメチル)-1,2,4- オキサジアゾール-3- イル]フェニル]シク ロヘキサ-3-エン-1- カルボキサミド		1.47	382.26	B	
1.32	2-(3,5-ジクロロ-2- ピリジル)-2-メチル- N-[4-[5-(トリフルオ ロメチル)-1,2,4-オ キサジアゾール-3-イ ル]フェニル]プロパ ンアミド		2.01	445.23	B	
1.33	5-tert-ブチル-2-メチ ル-N-[3-[[4-[5-(トリ フルオロメチル)-1, 2,4-オキサジアゾー ル-3-イル]フェニル] カルバモイル]フェ ニル]ピラゾール-3- カルボキサミド		1.69	513.35	B	
1.34	5-フルオロ-N-[4-[5- (トリフルオロメチ ル)-1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]フ ェニル]-1,2,3-ベン ゾチアジアゾール-7- カルボキサミド		1.92	410.21	B	
1.35	2-[4-(3-フルオロフ ェノキシ)フェノキ シ]-N-[4-[5-(トリフ ルオロメチル)-1,2,4 -オキサジアゾール-3 -イル]フェニル]アセ トアミド		2.05	474.32	B	

10

20

30

40

【表 8 - 8】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.36	2-(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.61	410.28	B	
1.37	2-アニリノ-5-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]チアゾール-4-カルボキサミド		2.11	446.29	B	
1.38	3-ベンジルオキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド		2.03	440.30	B	
1.39	4-ブromo-2-メチル-1,1-ジオキソ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボキサミド		1.73	515.61	B	
1.40	2-(4-ブromoフェニル)-2,2-ジフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		2.00	462.10	B	

10

20

30

40

【表 8 - 9】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.41	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]テトラヒドロフラン-2-カルボキサミド		1.57	328.23	B	115 - 120
1.42	4-イミダゾール-1-イル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド		1.16	400.23	B	
1.43	5-プロモ-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ピラゾール-3-カルボキサミド		1.83	513.18	B	
1.44	2-フェニルスルファニル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.79	380.23	B	
1.45	N-アセチル-N-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-ピリジル]アセトアミド		0.89	315	A	
1.46	N-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-ピリジル]ベンズアミド					172.8 - 174.3

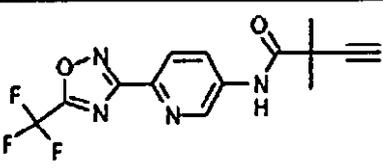
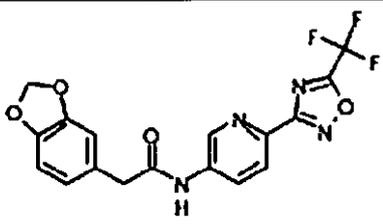
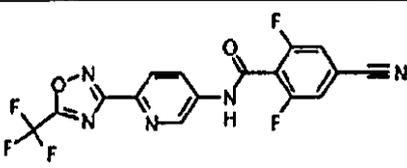
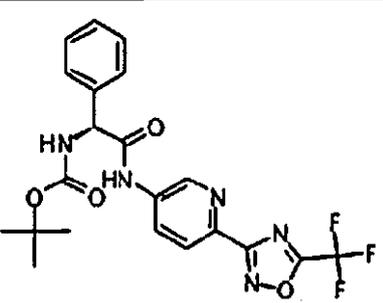
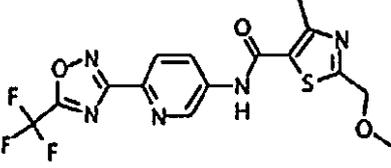
10

20

30

40

【表 8 - 10】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.47	2,2-ジメチル-N-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]ブタ-3-イナミド		1.51	325.1	B	
1.48	2-(1,3-ベンゾジオキサソール-5-イル)-N-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]アセトアミド		1.47	392.97	B	
1.49	4-シアノ-2,6-ジフルオロ-N-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]ベンズアミド		1.53	395.93	B	
1.50	tert-ブチル N-[(1S)-2-オキソ-1-フェニル-2-[[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]アミノ]エチル]カルバメート		1.72	464.19	B	
1.51	2-(メトキシメチル)-4-メチル-N-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]チアゾール-5-カルボキサミド		1.44	399.97	B	

10

20

30

40

【表 8 - 1 1】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.52	2-(4-アセトアミドフェニル)-N-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]アセトアミド		1.23	406.01	B	
1.53	2-(3,5-ジクロロ-2-ピリジル)-2-メチル-N-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]プロパンアミド		1.81	445.95	B	
1.54	4-イミダゾール-1-イル-N-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]ベンズアミド		1.02	401.12	B	
1.55	2-フェニルスルファニル-N-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]アセトアミド		1.58	381.03	B	
1.56	2-[N-アセチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]-N-tert-ブチル-アセトアミド		1.58	3.85	A	

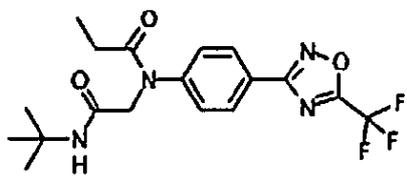
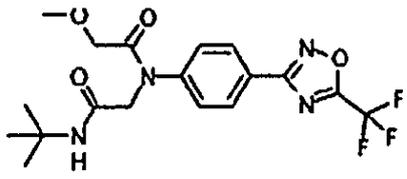
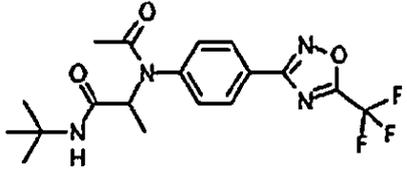
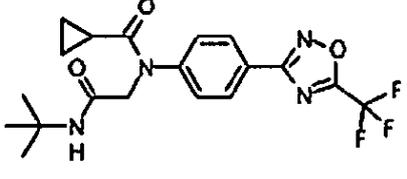
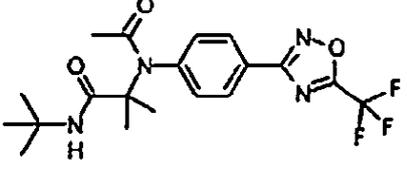
10

20

30

40

【表 8 - 1 2】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.57	N-[2-(tert-ブチルアミノ)-2-オキソ-エチル]-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.71	399	A	
1.58	N-tert-ブチル-2-[N-(2-メトキシアセチル)-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]アセトアミド		1.57	415	A	
1.59	2-[N-アセチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]-N-tert-ブチル-プロパンアミド		1.74	399	A	
1.60	N-[2-(tert-ブチルアミノ)-2-オキソ-エチル]-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド					110 - 112
1.61	2-[N-アセチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]-N-tert-ブチル-2-メチル-プロパンアミド		1.8	413	A	

10

20

30

40

【表 8 - 1 3】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.62	N-tert-ブチル-2-[N-(2-メトキシアセチル)-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]プロパンアミド					115 - 117
1.63	1-メトキシ-3-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-ピリジル]尿素					151 - 154
1.64	1-メトキシ-1-メチル-3-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-ピリジル]尿素					83 - 87
1.65	1-メトキシ-1-メチル-3-[6-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-3-ピリジル]尿素		0.89	318	A	
1.66	1-(3-メチルブタ-2-エノキシ)-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					118 - 121
1.67	1-エチル-1-メトキシ-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					113 - 116

10

20

30

40

【表 8 - 1 4】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.68	1-メトキシ-1-(2-メトキシエチル)-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					89 - 92
1.69	1-(シクロプロピルメチル)-1-メトキシ-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					117 - 120
1.70	1-(2-メチルアリロキシ)-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					134 - 137
1.71	2-(4-メトキシフェニル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.72	378.3	B	
1.72	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]テトラヒドロピラン-2-カルボキサミド		1.77	342.2	B	
1.73	メチル 2,2-ジメチル-4-オキソ-4-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]ブタノエート		1.67	372.3	B	

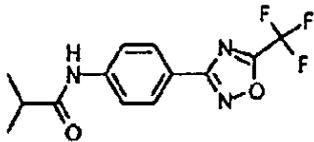
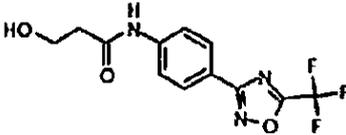
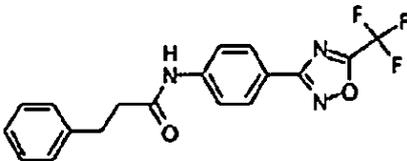
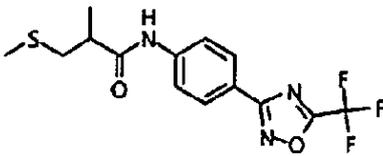
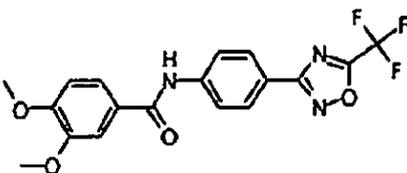
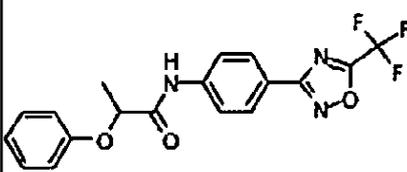
10

20

30

40

【表 8 - 15】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.74	2-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.63	300.2	B	
1.75	3-ヒドロキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.25	302.2	B	
1.76	3-フェニル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.82	362.3	B	
1.77	2-メチル-3-メチルスルファニル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.69	346.2	B	
1.78	3,4-ジメトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド		1.70	394.3	B	
1.79	2-フェノキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.87	378.3	B	

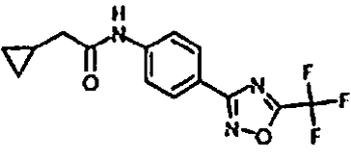
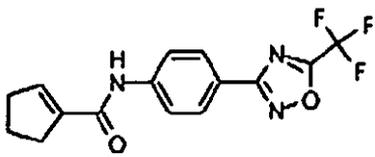
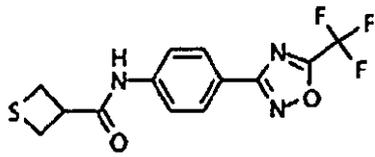
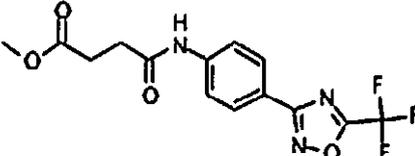
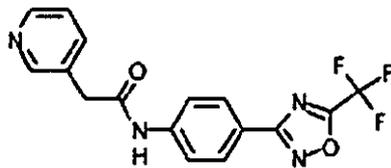
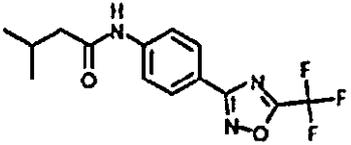
10

20

30

40

【表 8 - 16】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.80	2-シクロプロピル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.63	312.2	B	
1.81	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロペンテン-1-カルボキサミド		1.74	324.2	B	
1.82	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]チエタン-3-カルボキサミド		1.63	330.2	B	
1.83	メチル 4-オキソ-4-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]ブタノエート		1.50	344.2	B	
1.84	2-(3-ピリジル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.11	349.2	B	
1.85	3-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンアミド		1.73	314.3	B	

10

20

30

40

【表 8 - 17】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.86	2-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ペンタンアミド		1.83	328.3	B	
1.87	2-(5-メチルピラゾール-1-イル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.50	352.3	B	
1.88	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ペンタ-4-エナミド		1.67	312.2	B	
1.89	2-(2-チエニル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.70	354.2	B	
1.90	2-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.69	312.2	B	
1.91	2-エチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンアミド		1.81	328.3	B	

10

20

30

40

【表 8 - 1 8】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.92	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ペンタンアミド		1.75	314.3	B	
1.93	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ヘプタ-6-エナミド		1.87	340.3	B	
1.94	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタ-3-エナミド		1.57	298.2	B	
1.95	[2-オキソ-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]アニリノ]エチル]アセテート		1.45	330.2	B	
1.96	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]テトラヒドロチオピラン-4-カルボキサミド		1.70	358.2	B	
1.97	2-(3,3-ジフルオロシクロブチル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.72	362.2	B	

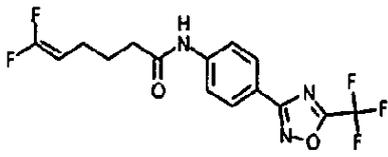
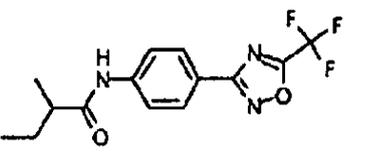
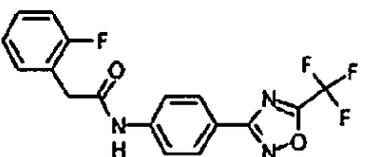
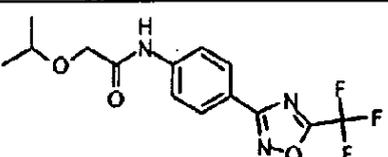
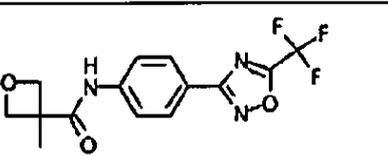
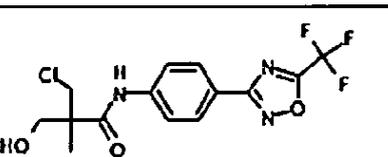
10

20

30

40

【表 8 - 19】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.98	6,6-ジフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ヘキサ-5-エナミド		1.81	362.2	B	
1.99	2-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンアミド		1.73	314.2	B	
1.100	2-(2-フルオロフェニル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.75	366.2	B	
1.101	2-イソプロポキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.74	330.2	B	
1.102	3-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]オキセタン-3-カルボキサミド		1.46	328.2	B	
1.103	2-(クロロメチル)-3-ヒドロキシ-2-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.59	364.2	B	

10

20

30

40

【表 8 - 20】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.104	2-ピラゾール-1-イル -N-[4-[5-(トリフル オロメチル)-1,2,4- オキサジアゾール-3- イル]フェニル]アセ トアミド		1.42	338.2	B	
1.105	3-(3-ピリジル)-N-[4 -[5-(トリフルオロメ チル)-1,2,4-オキサ ジアゾール-3-イル] フェニル]プロパン アミド		1.06	363.3	B	
1.106	3-オキソ-N-[4-[5- (トリフルオロメチ ル)-1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル]フ ェニル]シクロブタ ンカルボキサミド		1.46	326.2	B	
1.107	3-(4-ピリジル)-N-[4 -[5-(トリフルオロメ チル)-1,2,4-オキサ ジアゾール-3-イル] フェニル]プロパン アミド		1.03	363.3	B	
1.108	N-[4-[5-(トリフルオ ロメチル)-1,2,4-オ キサジアゾール-3-イ ル]フェニル]-2-[6- (トリフルオロメチ ル)-3-ピリジル]アセ トアミド		1.73	417.3	B	
1.109	3-(1-ピペリジル)-N- [4-[5-(トリフルオロ メチル)-1,2,4-オキ サジアゾール-3-イ ル]フェニル]プロパ ンアミド		1.05	369.3	B	

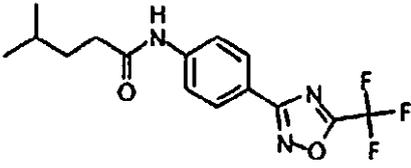
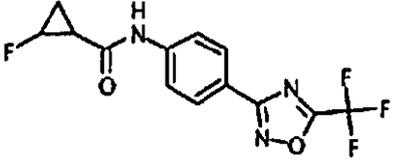
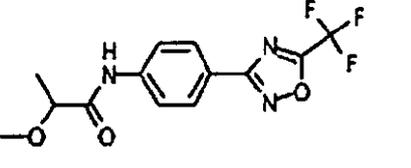
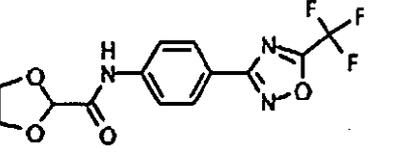
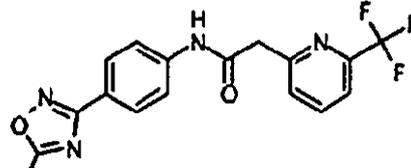
10

20

30

40

【表 8 - 2 1】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.110	4-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ペンタンアミド		1.85	328.3	B	
1.111	2-フルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.50	316.2	B	
1.112	2-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.58	316.2	B	
1.113	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]-1,3-ジオキサラン-2-カルボキサミド		1.44	330.2	B	
1.114	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]-2-[6-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトアミド		1.78	417.3	B	

10

20

30

40

【表 8 - 2 2】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.115	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]-2-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトアミド		1.75	417.3	B	
1.116	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]テトラヒドロフラン-3-カルボキサミド		1.45	328.2	B	
1.117	2-(3,5-ジフルオロフェニル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.81	384.2	B	
1.118	2,2-ジフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.63	334.2	B	
1.119	2-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.94	432.3	B	

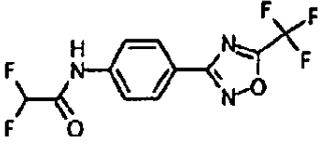
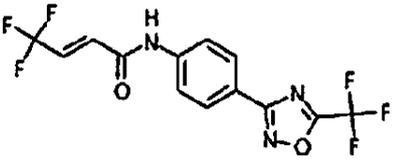
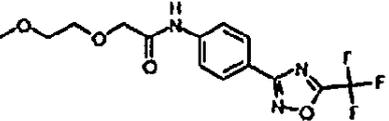
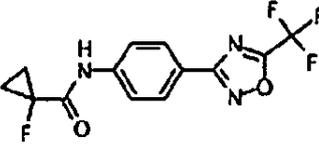
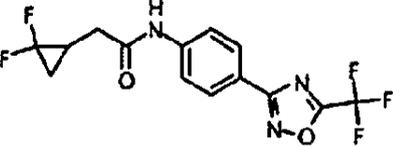
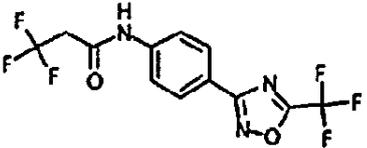
10

20

30

40

【表 8 - 23】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.120	2,2-ジフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.53	308.4	B	
1.121	(E)-4,4,4-トリフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタ-2-エナミド		1.79	352.2	B	
1.122	2-(2-メトキシエトキシ)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.54	346.3	B	
1.123	1-フルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.68	316.2	B	
1.124	2-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.66	348.2	B	
1.125	3,3,3-トリフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.62	340.2	B	

10

20

30

40

【表 8 - 2 4】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.126	1-メトキシ-1,3-ジメチル-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素		1.1	331	A	
1.127	1-[(2-フルオロフェニル)メトキシ]-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					140 - 143
1.128	N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.61	312.1	B	
1.129	2-メトキシ-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.37	316.1	B	
1.130	4-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ピペラジン-1-カルボキサミド					164 - 167
1.131	1-メチル-1-(2-メチルアリルオキシ)-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					65 - 68

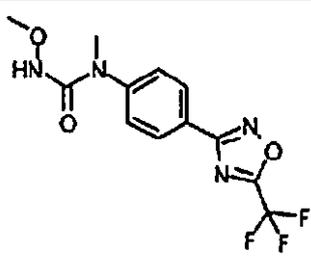
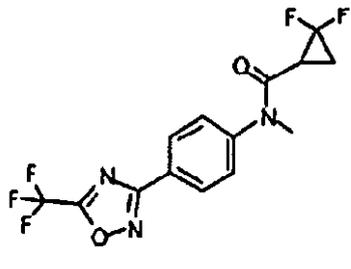
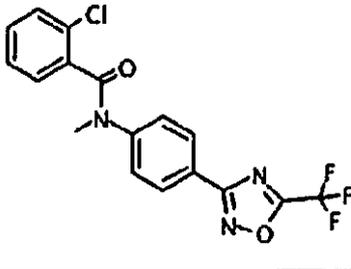
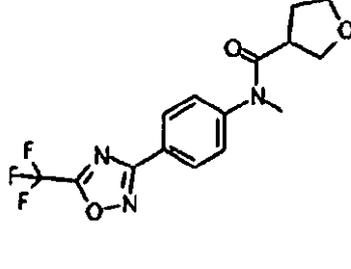
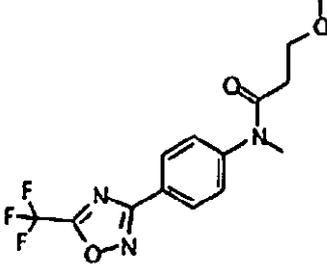
10

20

30

40

【表 8 - 25】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.132	3-メトキシ-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素			317	A	73 - 76
1.133	2,2-ジフルオロ-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.65	348.1	B	
1.134	2-クロロ-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド		1.75	382.1	B	
1.135	N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]テトラヒドロフラン-3-カルボキサミド		1.44	342.1	B	
1.136	3-メトキシ-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.46	330.2	B	

10

20

30

40

【表 8 - 2 6】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.137	N,2-ジメチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.72	326.2	B	
1.138	N,1-ジメチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.66	326.1	B	
1.139	N,3-ジメチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]オキサタン-3-カルボキサミド		1.40	342.1	B	
1.140	4-メトキシ-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンアミド		1.52	344.2	B	
1.141	N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]テトラヒドロフラン-2-カルボキサミド		1.47	342.1	B	

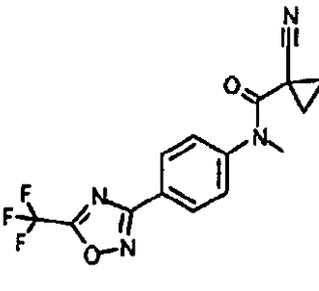
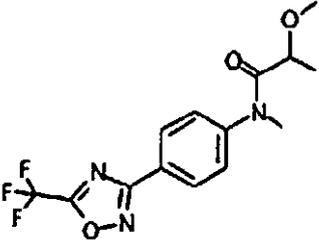
10

20

30

40

【表 8 - 27】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
1.142	1-シアノ-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.50	337.1	B	
1.143	2-メトキシ-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.45	330.2	B	

10

20

【0253】

【表 9 - 1】

表 T2:式(I)および(IA)による化合物についての融点(mp)データ及び/又は保持時間(R<sub>t</sub>):

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
2.1	2-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド					93 - 94
2.2	2,2,2-トリフルオロ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド					146 - 147
2.3	1-アリルオキシ-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					124 - 127
2.4	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ペンタ-4-イナミド		1.55	310.2	B	
2.5	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンアミド		1.63	300.2	B	
2.6	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロペンタンカルボキサミド		1.78	326.3	B	

10

20

30

40

【表 9 - 2】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
2.7	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロペンタ-3-エン-1-カルボキサミド		1.71	324.2	B	
2.8	3-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.45	316.2	B	
2.9	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロブタンカルボキサミド		1.69	312.2	B	
2.10	2-エトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.61	316.2	B	
2.11	1-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.69	312.2	B	
2.12	2,2-ジメチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.82	326.3	B	

10

20

30

40

【表 9 - 3】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
2.13	2-シアノ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.39	297.2	B	
2.14	1-シアノ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.60	323.2	B	
2.15	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.57	298.2	B	
2.16	4-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ブタンアミド		1.52	330.3	B	
2.17	N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド					78 - 86
2.18	N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		0.98	286	A	

10

20

30

40

【表 9 - 4】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
2.19	エチル N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート					27 - 32
2.20	N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]ベンズアミド		1.1	348	A	
2.21	1-アリルオキシ-1-メチル-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素		1.1	327	A	
2.22	1-(2,2,2-トリフルオロエチル)-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素		1.01	355	A	
2.23	N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]オキサジナソ-2-カルボキサミド					117 - 120
2.24	エチル N-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート		1.14	質量は検 出せず	A	

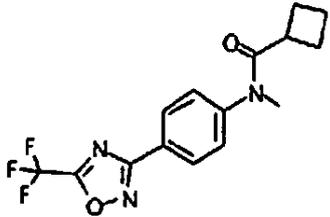
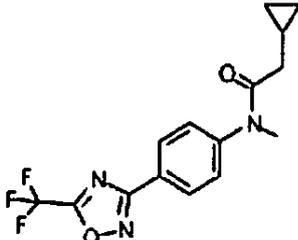
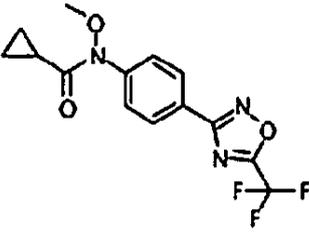
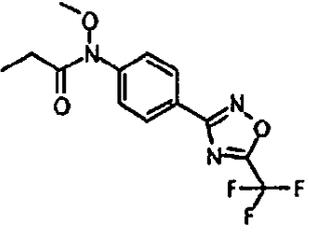
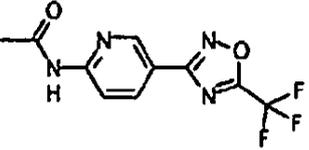
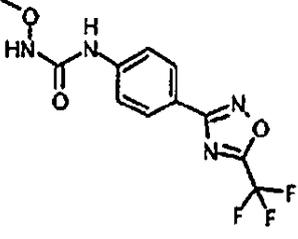
10

20

30

40

【表 9 - 5】

項目	名称	構造	R <sub>t</sub> (分)	[M+H] (測定値)	方法	mp(°C)
2.25	N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロブタンカルボキサミド		1.72	326.2	B	
2.26	2-シクロプロピル-N-メチル-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド		1.65	326.2	B	
2.27	N-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		1.13	328	A	
2.28	N-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]プロパンアミド		1.11	316	A	
2.29	N-[5-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]-2-ピリジル]アセトアミド		0.87	273	A	
2.30	1-メトキシ-3-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]尿素					152 - 155

10

20

30

40

## 生物学的実施例

ウェルプレートにおける葉片テストの一般的実施例：

様々な植物種の葉片または葉切片を、温室で生育した植物から切り取る。切り取られた葉片または葉切片を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の素寒天培地上に載せる。播種前（予防）または播種後（治療）に、葉片にテスト溶液を噴霧する。テストされる化合物を、DMSO溶液（最大10mg/ml）として調製し、それを、噴霧の直前に0.025%のTween 20で適切な濃度に希釈する。播種された葉片または葉切片を、それぞれのテストシステムに応じて、所定の条件（温度、相対湿度、光など）下でインキュベートする。病害のレベルの単一の評価を、病原体応答系に応じて、播種から3～14日後に行う。次いで、未処理の検査用葉片または葉切片と比した病害防除割合を計算する。

### 【0255】

ウェルプレートにおける液体培養テストの一般的実施例：

真菌の液体培養から新たに調製されたかまたは極低温保管しておいた真菌の菌糸体断片または分生子懸濁液を、栄養液体培地に直接混合する。テスト化合物（最大10mg/ml）のDMSO溶液を0.025%のTween 20で50倍に希釈し、10μlのこの溶液をピペットでマイクロタイタープレート（96ウェル型）に入れる。次いで、真菌の芽胞/菌糸断片を含有する栄養液体培地を加えて、テスト化合物の最終濃度を得る。テストプレートを、暗所にて24 および96%の相対湿度でインキュベートする。真菌の成長の阻害を、病原体応答系に応じて、2～7日後に測光法により計測し、未処理の対照と比した抗真菌活性割合を計算する。

### 【0256】

実施例1：プッシニアレコンディタf.sp.トリシチ（*Puccinia recondita* f.sp.*tritici*）に対する殺菌・殺カビ活性/コムギ/葉片予防（赤さび病）

コムギ葉切片（cv. Kanzler）を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天上に載せ、水で希釈された配合されたテスト化合物を噴霧した。葉片に、適用から1日後に真菌の孢子懸濁液を播種した。播種された葉切片を、気候キャビネット中において、12時間の光/12時間の暗闇の光環境下で、19 および75%の相対湿度（rh）でインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉切片に現われた時点で（適用から7～9日後）、未処理のものとは比した病害防除割合として評価した。

### 【0257】

以下の化合物は、適用される配合物中200ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

### 【0258】

化合物（表T1より）1.5、1.6、1.12、1.13、1.16、1.18、1.19、1.20、1.21、1.23、1.26、1.29、1.31、1.32、1.36、1.41、1.44、1.45、1.49、1.54、1.55、1.56、1.57、1.58、1.64、1.66、1.67、1.68、1.70、1.71、1.72、1.73、1.74、1.75、1.76、1.77、1.80、1.82、1.83、1.84、1.85、1.86、1.87、1.88、1.89、1.90、1.92、1.94、1.95、1.96、1.97、1.98、1.99、1.100、1.101、1.102、1.103、1.104、1.105、1.106、1.107、1.111、1.112、1.113、1.115、1.116、1.118、1.120、1.122、1.123、1.124、1.125、1.126、1.128、1.129、1.130、1.131、1.132、1.139、1.141、1.142、および1.143。

### 【0259】

化合物（表 T 2 より）2.1、2.3、2.4、2.5、2.6、2.7、2.9、2.11、2.13、2.15、2.16、2.17、2.18、2.19、2.20、2.23、2.24、2.25、2.29、および 2.30。

【0260】

実施例 2：ブッシニアレコンディタ *f. sp. tritici* (Puccinia recondita *f. sp. tritici*) に対する殺菌・殺カビ活性 / コムギ / 葉片治療 (赤さび病)

コムギ葉切片 (cv. Kanzler) を、マルチウェルプレート (24 ウェル型) 中の寒天上に載せる。次いで、葉切片に、真菌の孢子懸濁液を播種する。次いで、プレートを暗所にて 19 および 75% の相対湿度で保管した。水で希釈された配合されたテスト化合物を、播種から 1 日後に適用した。葉切片を、気候キャビネット中において、12 時間の光 / 12 時間の暗闇の光環境下で、19 および 75% の相対湿度でインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉片に現われた時点で (適用から 6 ~ 8 日後)、未処理のものとした病害防除割合として評価した。

【0261】

以下の化合物は、適用される配合物中 200 ppm で、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも 80% の病害防除をもたらす。

【0262】

化合物 (表 T 1 より) 1.5、1.41、1.45、1.55、1.56、1.67、1.68、1.70、1.73、1.74、1.75、1.77、1.87、1.99、1.101、1.102、1.104、1.107、1.111、1.112、1.116、1.123、1.126、1.128、1.129、1.130、1.131、1.132、1.135、1.136、1.139、1.140、1.141、1.142、および 1.143。

【0263】

化合物 (表 T 2 より) 2.1、2.3、2.4、2.5、2.7、2.13、2.15、2.16、2.17、2.18、2.19、2.20、2.23、2.25、2.27、および 2.29。

【0264】

実施例 3：ファコプソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) に対する殺菌・殺カビ活性 / ダイズ / 葉片予防 (アジア型ダイズさび病)

ダイズ葉片を、マルチウェルプレート (24 ウェル型) 中の素寒天培地上に載せ、水で希釈された配合されたテスト化合物を噴霧する。適用から 1 日後、下側の葉面に孢子懸濁液を噴霧することによって、葉片に播種する。気候キャビネット中において、20 および 75% の rh で、暗闇で 24 ~ 36 時間のインキュベーション期間の後、葉片を、12 時間の光 / 日および 75% の rh で、20 に保持する。化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉片に現われた時点で (適用から 12 ~ 14 日後)、未処理のものとした病害防除割合として評価する。

【0265】

以下の化合物は、適用される配合物中 200 ppm で、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも 80% の病害防除をもたらす。

【0266】

化合物 (表 T 1 より) 1.1、1.2、1.4、1.5、1.6、1.12、1.16、1.20、1.27、1.29、1.31、1.36、1.41、1.45、1.46、1.51、1.53、1.54、1.55、1.63、1.67、1.68、1.70、1.71、1.72、1.73、1.74、1.81、1.85、1.86、1.90、1.91、1.92、1.99、1.102、1.111、1.112、1.118、1.123、1.124、1.125、1.128、1.130、1.131、1.13

10

20

30

40

50

3、1.135、1.136、1.137、1.138、1.139、1.140、1.141、1.142、および1.143。

【0267】

化合物(表T2より)2.1、2.3、2.4、2.5、2.7、2.11、2.13、2.16、2.17、2.19、2.20、2.23、2.25、2.27、2.28、および2.29。

【0268】

実施例4:グロメララゲナリウム(*Glomerella lagenarium*)(コレトトリカムラゲナリウム(*Colletotrichum lagenarium*))に対する殺菌・殺カビ活性、液体培養/キュウリ/予防(炭疽病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地(PDB-ジャガイモブドウ糖液体培地)に直接混合する。テスト化合物の(DMSO)溶液をマイクロタイタープレート(96ウェル型)に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを24でインキュベートし、適用から3~4日後に、成長の阻害を測光法により計測する。

【0269】

以下の化合物は、適用される配合物中20ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

【0270】

化合物(表T1より)1.1、1.4、1.5、1.10、1.12、1.13、1.15、1.16、1.19、1.20、1.23、1.29、1.31、1.36、1.39、1.41、1.44、1.45、1.48、1.54、1.55、1.56、1.57、1.60、1.63、1.64、1.65、1.66、1.67、1.68、1.69、1.70、1.71、1.72、1.73、1.74、1.75、1.76、1.77、1.79、1.80、1.81、1.82、1.83、1.84、1.85、1.86、1.87、1.88、1.89、1.90、1.91、1.92、1.93、1.94、1.95、1.96、1.97、1.98、1.99、1.100、1.101、1.102、1.103、1.104、1.105、1.106、1.107、1.108、1.110、1.111、1.112、1.113、1.114、1.115、1.116、1.117、1.118、1.119、1.120、1.122、1.123、1.124、1.125、1.126、1.127、1.128、1.129、1.130、1.131、1.132、1.134、1.135、1.136、1.137、1.139、1.140、1.141、1.142、および1.143。

【0271】

化合物(表T2より)2.1、2.2、2.3、2.4、2.5、2.6、2.7、2.9、2.10、2.11、2.12、2.13、2.15、2.16、2.17、2.18、2.19、2.20、2.21、2.22、2.23、2.25、2.26、2.27、2.28、2.29、および2.30。

【0272】

実施例5

ソラマメさび病菌(*Uromyces viciae-fabae*)に対する殺菌・殺カビ活性/ソラマメ(field bean)/葉片予防(空豆さび病(*Faba-bean rust*))

ソラマメの葉片を、マルチウェルプレート(96ウェル型)中の素寒天上に置き、10μlの配合した試験化合物をアセトンに希釈し、スプレッターを葉片上へとピペットで移した。適用の2時間後に、葉裏上に胞子の懸濁液を噴霧することによって葉片を播種する。葉片を、1日18時間および70%相対湿度を伴う気候キャビネットにおいて22でインキュベートする。適切なレベルの病害による損傷が未処理の検査用葉片において現れたとき(適用後12日)、化合物の活性を未処理と比較した病害防除パーセントとしてア

10

20

30

40

50

セメントする。

【0273】

下記の化合物は、適用される配合物中100ppmで大幅な病害の発生を示す、同じ条件下での未処理の対照葉片と比較したとき、この試験において少なくとも80%の病害防除をもたらす。

【0274】

化合物(表T1より) 1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11、1.13、1.14、1.15、1.16、1.17、1.20、1.22、1.23、1.24、1.25、1.28、1.29、1.30、1.31、1.32、1.33、1.34、1.35、1.37、1.38、1.39、1.40、1.41、1.42、1.43、1.45、1.46、1.56、1.57、1.58、1.59、1.60、1.61、および1.62。

10

【0275】

化合物(表T2より) 2.1、2.2、2.3、および2.25。

## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2017/074134
---

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> INV. C07D413/14 C07D413/12 C07D417/12 C07D471/04 C07D271/06 C07D513/04 A01N43/82 ADD. According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b> Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 276 432 A2 (CIBA GEIGY AG [CH]) 3 August 1988 (1988-08-03) page 1, line 1 - line 5; claims 1,10,15-20; table 3 -----	1-15
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
11 October 2017		19/10/2017
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer  Von Daacke, Axel

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2017/074134

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0276432	A2	03-08-1988	
		AU 8246587 A	16-06-1988
		BR 8706756 A	19-07-1988
		DK 650787 A	13-06-1988
		EP 0276432 A2	03-08-1988
		NZ 222868 A	26-09-1990
		PT 86329 A	01-01-1988
		US 4871753 A	03-10-1989
-----			

## フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I		テーマコード(参考)
C 0 7 D 471/04	(2006.01)	C 0 7 D	471/04	1 0 8 A
C 0 7 D 413/14	(2006.01)	C 0 7 D	413/14	
C 0 7 D 513/04	(2006.01)	C 0 7 D	513/04	3 4 3
C 0 7 D 417/12	(2006.01)	C 0 7 D	417/12	
C 0 7 D 413/04	(2006.01)	C 0 7 D	413/04	
C 0 7 D 417/14	(2006.01)	C 0 7 D	417/14	
A 0 1 N 47/30	(2006.01)	A 0 1 N	47/30	D
A 0 1 N 47/12	(2006.01)	A 0 1 N	47/12	1 0 2

(81) 指定国・地域 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT

(特許庁注：以下のものは登録商標)

1 . T W E E N

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74)代理人 100196405

弁理士 小松 邦光

(72)発明者 ホフマン トマス ジェイムズ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ  
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 スティエルリ ダニエル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ  
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ボーデニエ ルノー

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ  
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 プリオ マルティン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ  
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

Fターム(参考) 4C056 AA01 AB02 AC05 AD01 AE03 FA13 FB01 FC01

4C063 AA01 AA03 BB01 BB09 CC58 CC62 CC67 CC72 CC73 CC76

CC78 CC81 CC82 CC91 CC92 CC94 CC95 DD12 DD14 DD22

DD25 DD29 DD34 DD41 DD51 DD54 DD58 EE03

4C065 AA03 BB06 CC01 DD02 EE02 HH08 JJ01 KK01 LL01 PP16

4C072 AA01 BB02 CC03 CC16 EE12 FF07 GG09 HH02 HH07

4H011 AA01 AA03 BB10 DA13 DC05 DD03 DE15